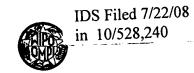


国際事務局



; 7:

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類 5 C07C 215/10, 233/18, 215/24 C07C 215/28, 323/25, 225/06 C07C 229/22, 219/04, 217/28	(1)) 国際公開番号 WO 94/0894
A61K 31/13, 31/195, 31/215 A61K 31/24	(43)国際公開日 1994年4月28日 (28.04.199
(21)国際出題番号 PCT/JP93 (22)国際出題日 1993年10月18日(18. (30)優先権データ		• • • • • • • • • • • • • • • • • • • •
特顧平4/283281 1992年10月21日(21.10.92) 特顯平5/179427 1993年7月20日(20.07.93)	JP JP	弁理士 高島 — (TAKASHIMA, Hajime) 〒541 大阪府大阪市中央区平野町三丁目3番9号 湯木ビル Osaka, (J)
(71)出願人(米国を除くすべての指定国について) 吉富製薬株式会社 (YOSHITOMI PHARMACEUTICAL INDUSTRIES, LTD.) 【JP/JP】		(81)指定国 CA, JP, KR, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MO, NL, PT, SE).
〒541 大阪府大阪市中央区平野町二丁目6番9号 Osaka, (JP台橋株式会社(TAITO CO., LTD.)(JP/JP) 〒103 東京都中央区日本橋大伝馬町7番5号 Tokyo, (JP) (72)発明者; および	P)	添付公開書類 国際調査報告
(75)発明者/出願人(米国についてのみ) 藤多哲朗(FUJITA, Tetsuro)[JP/JP] 〒617 京都府向日市癌証井町大極酸40番地23 Kyoto,(JP 佐々木重夫(SASAKI, Shigeo)[JP/JP]	P)	
〒654 兵庫県神戸市須磨区須磨寺町4丁目5番8号201 Hyog 米田雅彦(YONETA, Masahiko)[JP/JP]	go, (JP)	

(54) Title: 2-AMINO-1,3-PROPANEDIOL COMPOUND AND IMMUNOSUPPRESSANT

(54) 発明の名称 2-アミノー1,3-ブロパンジオール化合物および免疫抑制剤

〒654 兵庫県神戸市須磨区須磨寺町4丁目5番8号303 Hyogo, (JP)

三品 正(MISHINA, Tadashi)[JP/JP] 安達邦知(ADACHI, Kunitomo)[JP/JP]

$$R^{2}R^{3}N \xrightarrow{CH_{2}OR^{4}} CH_{2}OR^{5} \qquad (I)$$

(57) Abstract

A 2-amino-1,3-propanediol compound represented by general formula (I) or a pharmaceutically acceptable salt thereof, and an immunosuppressant containing the same as the active ingredient. In said formula R represents optionally substituted linear or branched carbon chain, optionally substituted aryl or optionally substituted cycloalkyl; and R², R³, R⁴ and R⁵, which may be the same or different from one another, represent each hydrogen, alkyl, aralkyl, acyl or alkoxycarbonyl. The compound is immunodepressant and useful as an inhibitor against rejection in organ or bone marrow transplantation, as a preventive or remedy for autoimmune diseases and so forth, or a reagent in the medical and pharmaceutical fields.

(57) 要約

一般式(I)

$$R^{2}R^{3}N \xrightarrow{CH_{2}OR^{4}} CH_{2}OR^{5} \qquad (I)$$

(式中、Rは置換基を有していてもよい直鎖あるいは分枝鎖状の炭素鎖、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいシクロアルキル等を、R²、R³、R⁴、R⁵は同一または異なって水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。)

により表される2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上 許容される塩、およびこれらを活性成分として含有する免疫抑制剤。

本発明の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物類は免疫抑制作用を示し、臓器や骨髄移植の際の拒絶反応の抑制、自己免疫疾患等における予防または 治療剤として、あるいは医学、薬学における試薬として有用である。

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第1頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

KR 大韓民国 KZ 大韓民国 A カザビテンシュ タ カザビテンンカブレ LV フトナーン グ MC マン・ア カル MC ママモン・リータイン MN モン・リータイン MN モマン・リーン ア MW ママモ・ア ル MW ママモ・ア ル MW ママモ・ア リー・ア ト NE コノニュー・ア ド

明細書

2-アミノー1,3-プロパンジオール化合物および免疫抑制剤「技術分野」

本発明は、医薬、特に免疫抑制剤として有用な2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物類に関する。

「背景技術」

近年、臓器移植の際に生ずる拒否反応を抑制するためにシクロスポリンが使用されている。開発中の化合物も含めて、いわゆる免疫抑制剤は、さらに関節リウマチ等の治療薬としても期待されてきている。しかしながら、前記シクロスポリンは腎障害等の副作用を生起するという問題点を有している。

一方、特開平1-104087号公報には、冬虫夏草菌(Isaria sinclairii)の液体培養物から免疫抑制物質が採取されることが記載され、当該物質は米国特許第3928572号明細書に開示された式

により表される(2S, 3R, 4R) - (E) -2-rミノ-3, 4-ジヒドロキシ-2-ヒドロキシメチル-14-オキソイコサ-6-エン酸であることが確認されている。さらに、特開平3-128347号公報には同系統の化合物が免疫抑制作用を有することが記載されている。

一方、メルク・インデックス (Merck Index)第11版により、2-アミノ-2-メチル-1,3-プロパンジオール(記事番号:460)、2-アミノ-2-エチル-1,3-プロパンジオール(記事番号:451)および2-アミノ-2-ヒドロキシメチル-1,3-プロパンジオール(トロメタミンともいう、記事番号:9684)が、界面活性剤や医薬品等の合成中間体、乳化剤、またガス吸着剤等として用いられること、およびトロメタミンはアルカリ化剤としての医薬用途を有していることが知られている。特開昭62-416号公報によると、2

1

-アミノ-2-(炭素数1~5のアルキル)-1,3-プロパンジオールを含有 する染毛剤が開示されている。また、米国特許第4910218号明細書および ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー(J. Med. Chem.) 第33巻2 385~2393頁(1990年)には、抗腫瘍剤の合成中間体として、2-ア ミノー2-(メチルまたはエチル)-1,3-プロパンジオールが記載されてい る。特開昭59-192962号公報には、抗原または抗体感作ラテックス試薬 の安定剤として、前記2-アミノ-2-(炭素数1~5のアルキル)-1, 3- 4 プロパンジオールまたは2-アミノー1,3-プロパンジオールが使用できる旨 の開示がなされている。さらに、米国特許第3062839号明細書には、トラ ンキライザー作用を有する2-メチルまたはエチルアミノ-2-(フリルメチル、 フェニルメチルまたは低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもし くは無置換アミンにより置換されたフェニルメチル)-1,3-プロパンジオー ルが、ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー(J. Org. Chem.)第2 5巻2057~2059頁(1960年)には、2-メチルアミノー2-(フェニルメチ ルまたは2-メチル、3-メチル、4-メチル、4-メトキシもしくは4-ヒド ロキシにより置換されたフェニルメチル)-1,3-プロパンジオールが記載さ れている。しかしながら、これら化合物が臓器等の移植時に発生する拒絶反応の 抑制作用や、自己免疫疾患の予防もしくは治療効果等、免疫抑制作用を有するこ とは知られていない。

本発明の目的は、すぐれた免疫抑制作用を示し、かつ副作用の少ない新規な2 -アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物類を提供することである。 <u>.</u>

1/1.

「発明の開示」

本発明は、(1)一般式

$$R^{2}R^{3}N \longrightarrow C \longrightarrow CH_{2}OR^{5}$$
(1)

〔式中、Rは置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖 {当該鎖中

.

に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R^6)ー(ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体が置換していてもよい)または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいアリールもしくはその脂環体を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示すか、 R^4 、 R^5 がアルキル、アリールまたはアラルキルにより置換されていてもよいアルキレン鎖により結合していてもよい。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハ

ロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。 さらに、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。

ただし、Rが炭素数 $1\sim 5$ 個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、Rがフリルメチル、フェニルメチルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニルメチルのとき、 R^2 、 R^3 の一方はメチルまたはエチルではない。 R^3 により表される R^3 この一方はメチルとの製薬上許容される塩。

...

(2) 一般式

$$R^{2}R^{3}N \xrightarrow{C} CH_{2}OR^{5} \qquad (I-1)$$

$$CH_{2}R^{1}$$

〔式中、R¹は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖 (当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N (R⁵)-(ここで、R⁵ は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端 (ω位)に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していて

もよいへテロアリールもしくはその脂環体が置換していてもよい $}$ または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示すか、 R^4 、 R^5 がアルキル、アリールまたはアラルキルにより置換されていてもよいアルキレン鎖により結合していてもよい。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリール
オキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよい・クロアルキルまたは置換基を有していてもよい・クロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。

ただし、 R^1 が炭素数 $1\sim 4$ 個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、 R^1 がフリル、フェニルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニ

ルのとき、 R^2 、 R^3 の一方はメチルまたはエチルではない。〕により表される上記(1)の2-7ミノー1,3-7ロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(3)一般式

$$CH_2OR^4a$$
 $R^2aR^3aN \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OR^5a$
 CH_2R^1a
(I-2)

〔式中、 R^1a は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖(当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R^6)-(ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいフェニレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンから選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよい)、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいシクロアルキルを示し、 R^2a 、 R^3a 、 R^4a 、 R^5a は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。

ここで、置換基を有していてもよいフェニルおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルは、置換基として、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖(当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R°)-(ここで、R°は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいフェニレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンから選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよい〉、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいフェノキシ、置換基を有していてもよいフェノキルから

選ばれる基を有していてもよい。

また、置換基を有していてもよい炭素鎖は、置換基として、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいシクロアルキルから選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいフェニレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいシクロアルキルは、その置換基として、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル、カルボニル、アシルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。

ただし、 R^1a が炭素数 $1 \sim 4$ 個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、 R^1a がフリル、フェニルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニルのとき、 R^2a 、 R^3a の一方はメチルまたはエチルではない。〕により表される上記(1)または(2)の2-アミノー1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(4)一般式

$$CH_2OR^4b$$
 $R^2bR^3bN \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OR^5b$ (I-3)
 CH_2R^1b

〔式中、R¹bは置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよい

アルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいフェニルまたは置換基を有していてもよいシクロアルキルを示し、 $R^{2}b$ 、 $R^{3}b$ 、 $R^{5}b$ は同一または異なってそれぞれ水素、アルキルまたはアシルを示す。

ここで、置換基を有していてもよいアルキール、置換基を有していてもよいアルケール、置換基を有していてもよいアルキールは、置換基としてアルコキシ、アルケールオキシ、アルキールオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボール、アルコキシカルボールアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいフェニルおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルから選ばれる基を有していてもよいシクロアルキルは、置換基として、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキールオキシ、アカードー、アルオ・シ、アルキン、アルコキシカルボニルアミノ、アルオ・シ、アルオ・シ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシおよびカルボキシから選ばれる1~3個を有することができる。

ただし、 R^1b が炭素数 $1\sim 4$ 個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、 R^1b がフリル、フェニルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニルのとき、 R^2b 、 R^3b の一方はメチルまたはエチルではない。〕により表される上記(3)の 2- アミノー 1 、3- プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(5) 一般式

$$R^{2}bR^{3}bN \xrightarrow{C} CH_{2}OR^{5}b \qquad (I-4)$$
Ra

〔式中、Ra は鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R 6) -(ここで、R 6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)およびカルボニルから選ばれる結合または複素原子を有していてもよく、また置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい炭素数12から22個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを示し、R 2 b、R 3 b、R 4 b、R 5 bは同一または異なってそれぞれ水素、アルキルまたはアシルを示す。〕により表される上記(1)、(2)、(3)または(4)の2-アミノー1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(6)一般式

$$R^2 c R^3 c N \longrightarrow C \longrightarrow C H_2 O H$$
 (1-5)

〔式中、Rb は鎖中に酸素原子を有していてもよく、また置換基として、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい炭素数13から20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを示し、R2c、R3cは同一または異なってそれぞれ水素、アルキルを示す。〕により表される上記(5)の2-アミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(7)一般式

$$H_2N \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OH$$
 (I-6)

〔式中、Rc は炭素数 1 3 から 2 0 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルまたは置

換基としてハロゲンを有する炭素数 1 3 から 2 0 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを示す。〕により表される上記(5)または(6)の 2 - アミノー 1 , 3 - プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(8) 2-rミノー2-hリデシルー1, 3-プロパンジオール、2-rミノー 2- アトラデシルー1, 3-プロパンジオール、2- アミノー2-ペンタデシルー1, 3-プロパンジオール、2- アミノー2- ヘキサデシルー1, 3-プロパンジオール、2- アミノー2- ヘプロパンジオール、2- アミノー2- オクタデシルー1, 3- プロパンジオール、2- アミノー2- オクタデシルー1, 3- プロパンジオール、2- アミノー2- オクタデシルー1, 3- プロパンジオール、2- アミノー2- (12- フルオロドデシル)ー1, 3- プロパンジオールおよび2- アミノー2- (14- フルオロテトラデシル)ー1, 3- プロパンジオールから選ばれる上記(5)、(6)または(7)の2- アミノー2- 1, 3- プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(9) 一般式

$$H_2N$$
 — CH_2OH C

〔式中、Rd はフェニルアルキル、置換フェニルアルキル、シクロアルキルアルキル、置換シクロアルキルアルキル、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロサイクリックアルキルまたは置換ヘテロサイクリックアルキルを示す。

ここで、アルキル部は炭素鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィール、スルホニル、 $-N(R^6)$ - (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す) およびカルボニルから選ばれる結合または複素原子を有していてもよく、また置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルア

ミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい。

また、置換フェニルアルキル、置換シクロアルキルアルキル、置換へテロアリールアルキルまたは置換へテロサイクリックアルキルは、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、ハロアラルキルオキシ、アラルキルオキシ、アルキルオキシ、アルキルステルキル、フェノキシアルキル、フェノキシアルコキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。〕により表される上記(1)、(2)、(3)または(4)の2-アミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(10)一般式

j

$$H_2N$$
 — CH_2OH (1-8)

〔式中、Re はアルキル部の炭素数が $6 \sim 20$ 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいフェニルアルキル;炭素数 $6 \sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルキル、炭素数 $6 \sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルコキシ、炭素数 $6 \sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、フェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシマルキル、フェノキシアルコキシもしくはフェノキシアルキルにより置換されたフェニルアルキル;アルキル部の炭素数が $6 \sim 20$ 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいシクロアルキルアルキル;アルキルの炭素数が $6 \sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状でもよいヘテロアルキル部の炭素数が $6 \sim 20$ 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいヘテロアルキルの炭素数が $6 \sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置

換されたヘテロアリールアルキル;アルキル部の炭素数が6~20個であって、 直鎖または分枝鎖状でもよいヘテロサイクリックアルキルまたは炭素数6~20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロサイクリックアル キルを示す。

ここで、アルキル部は炭素鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-N(R^6)-(ccc)$ 、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)およびカルボニルから選ばれる結合または複素原子を有していてもよく、また置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい。」により表される上記(9)の2-アミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(11) 一般式

$$H_2N \longrightarrow CH_2OH$$

$$H_2N \longrightarrow CH_2OH$$

$$Rf$$
(I-9)

〔式中、Rf はアルキル部の炭素数が $6 \sim 20$ 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が 1 または 2 個介在していてもよいフェニルアルキル;炭素数 $6 \sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルキル、炭素数 $6 \sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルコキシ、炭素数 $6 \sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、フェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシアルキル、フェノキシアルコキシもしくはフェノキシアルキルにより置換されたフェニルアルキル;アルキル部の炭素数が $6 \sim 20$ 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が 1 または 2 個介在していてもよいシクロアルキルアルキル;炭素数 $6 \sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状の

アルキルにより置換されたシクロアルキルアルキル;アルキル部の炭素数が $6\sim 20$ 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が 1 または 2 個介在していてもよいヘテロアリールアルキル;炭素数 $6\sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロアリールアルキル;アルキル部の炭素数が $6\sim 20$ 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が 1 または 2 個介在していてもよいヘテロサイクリックアルキルまたは炭素数 $6\sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロサイクリックアルキルを示す。

ここで、アルキル部は炭素鎖に置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい。)により表される上記(9)または(10)の2-アミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(12) 一般式

$$\begin{array}{c} CH_2OH \\ H_2N \longrightarrow \begin{array}{c} C \\ C \end{array} \longrightarrow CH_2OH \end{array} \qquad (I-10)$$

〔式中、Rg はアルキル部の炭素数が $6 \sim 20$ 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が 1 または 2 個介在していてもよいフェニルアルキル;炭素数 $6 \sim 14$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルキル、炭素数 $6 \sim 14$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルコキシ、炭素数 $6 \sim 14$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、フェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシマルキル、フェノキシアルコキシまたはフェノキシアルキルにより置換されたフェニルアルキル;アルキル部の炭素数が $6 \sim 20$ 個であるシクロアルキルアルキル;炭素数 $6 \sim 14$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換さ

れたシクロアルキルアルキル;アルキル部の炭素数が $6\sim20$ 個であるヘテロアリールアルキル;炭素数 $6\sim14$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロアリールアルキル;アルキル部の炭素数が $6\sim20$ 個であるヘテロサイクリックアルキルまたは炭素数 $6\sim14$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロサイクリックアルキルを示す。〕により表される上記(9)、(10)または(11)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(13)一般式

〔式中、Rh はアルキル部の炭素数が $6\sim20$ 個であるフェニルアルキル、アルキル部およびアルコキシ部の炭素数の総計が $6\sim20$ 個であるフェニルアルコキシアルキル、アルキル部の炭素数が $6\sim20$ 個であるフェノキシアルキルまたはアルキル部およびアルコキシ部の炭素数の総計が $6\sim20$ 個であるフェノキシアルコキシアルキルを示す。〕により表される上記(12)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

ロパンジオール、2-アミノー2-(8-フェニルメチルオキシオクチル)-1,3-プロパンジオール、2-アミノー2-(9-フェノキシノニル)-1,3-プロパンジオール、2-アミノー2-(12-フェノキシドデシル)-1,3-プロパンジオールおよび2-アミノー2-(6-(2-フェノキシエチルオキシ)ヘキシル)-1,3-プロパンジオールから選ばれる上記(13)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

$$\begin{array}{c} CH_2OH \\ H_2N \longrightarrow \stackrel{!}{C} \longrightarrow CH_2OH \end{array} \qquad (I-12)$$

(式中、Ri はハロゲンで置換されていてもよい炭素数 $6 \sim 1$ 4 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、ハロゲンで置換されていてもよい炭素数 $6 \sim 1$ 4 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシまたは炭素数 $6 \sim 1$ 4 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシにより置換されたフェニルアルキルを示す。ここで、フェニルアルキルのアルキル部はヒドロギシで置換されていてもよい。)により表される上記(12)の2-アミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(17) 一般式

(16)一般式

$$H_2N \xrightarrow{CH_2OH} CH_2OH$$
 (I-13)

〔式中、R 」はハロゲンで置換されていてもよい炭素数 $6\sim1$ 4個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、ハロゲンで置換されていてもよい炭素数 $6\sim1$ 4個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシまたは炭素数 $6\sim1$ 4個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシにより置換され、かつアルキル部が炭素数 $2\sim6$ のアルキルであって、当該アルキル部がヒドロキシで置換されていてもよいフェニルアルキルを示す。〕により表される上記(16)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

 $(18) 2 - 7 \le 1 - 2 - (2 - (4 - \sqrt{7} + \sqrt{7} + \sqrt{7}) + 1, 3 - 1, 3 - 1)$ プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-オクチルフェニル)エチル〕 エチル〕-1、3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-デシルフ ェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール、2-アミノー2-〔2-〔4-ウンデシルフェニル) エチル] -1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2- $[2-(4-i\pi)\nu]$ ミノー2-〔2-(4-トリデシルフェニル)エチル〕-1,3-プロパンジオ ール、2-アミノ-2-〔2-(4-テトラデシルフェニル)エチル〕-1.3 ープロパンジオール、2-アミノー2-〔2-(4-ヘキシルオキシフェニル) エチル) -1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-〔4-ヘプチル オキシフェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2 - (4-オクチルオキシフェニル) エチル) -1, 3-プロパンジオール、2-アミノー2- [2-(4-ノニルオキシフェニル) エチル] -1. 3-プロパン 3 -プロパンジオール、2 -アミノー2 - (2 - (4 -)) デシルオキシフェニル) エチル] -1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2- [2-(4-ドデ

シルオキシフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノー2- (2-(4-))デシルオキシフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノー2- (2-(4-(8-))7ロパンジオール)フェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノー2- (2-(4-(12-))7ロパンジオール、2-アミノー2- (2-(4-(12-))7ロパンジオール、2-アミノー2- (2-(4-(7-))7ロパンジオール、2-アミノー2- (2-(4-(7-))7ロパンジオール、2-7に2-(2-(4-(11-))7ロパンデシルオキシ)フェニル)エチル〕-11, 3-プロパンジオールおよび2-アミノー2- (2-(4-(7-)7カテニルオキシ)フェニル)エチル〕-11, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(16)または(17)の2-アミノー11, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(19) 2-r = 1-2-(2-(4-n) + n) x + n) -1, 3-1 プロパンジオール、2-r = 1-2-(2-(4-x) + n) x + n) x + n -1, 3-r = 1 + n -1,

(20)一般式

$$CH_2OH$$
 $H_2N \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OH$
 Rk
 $(I-14)$

〔式中、Rk はフェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシアルキル、フェノキシアルコキシまたはフェノキシアルキルにより置換されたフェニルアルキルを示す。〕により表される上記(12)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(21)一般式

$$CH_2OH$$
 $H_2N \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OH$
 R_1
 $(I-15)$

エチル】-1、3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-〔4-〔7-フ ェニルヘプチルオキシ)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール、2--1, $3-7\pi$ -1, $3-7\pi$ -1ェニル) ヘキシルオキシ) フェニル) エチル] -1, 3-プロパンジオール、2 エチル] -1, 3-プロパンジオール、2-アミノー2-[2-(4-(4-フ)ェノキシブチルオキシ)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール、2-アミノー2- [2-(4-(5-フェノキシペンチルオキシ) フェニル) エチル] -1.3-プロパンジオール、2-アミノー2-〔2-〔4-〔6-フェノキシ ヘキシルオキシ)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール、2-アミノ 3 -プロパンジオール、2 -アミノー2 - (2 - (4 - (4 -) x) + (4 +))フェニル) エチル] - 1, $3 - プロパンジオール、<math>2 - T \in J - 2 - (2 - (4 + 1))$ - (5-フェノキシペンチル)フェニル)エチル]-1、3-プロパンジオール、 $2-r \ge 1-2-(2-(4-(6-7)+2)+2)$ 1、3-プロパンジオールおよび2-アミノー2-〔2-〔4-〔7-フェノ キシヘプチル)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオールから選ばれる上 記 (20) または (21) の 2- アミノー 1 , 3- プロパンジオール化合物また はその製薬上許容される塩。

(23) 2-アミノ-2-[2-(4-(6-フェニルへキシルオキシ) フェニル) エチル] -1, 3-プロパンジオールおよび<math>2-アミノ-2-[2-(4-(5-フェニルペンチルオキシメチル) フェニル) エチル] -1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(20) または(21)の<math>2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(24)一般式

〔式中、Rm はアルキル部の炭素数の総計が $6\sim20$ 個であるアルキル置換シクロアルキルアルキルを示す。〕により表される上記(12)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(25) 2-アミノ-2-[3-(4-ヘプチルシクロヘキシル) プロピル] - 1, 3-プロパンジオール、<math>2-アミノ-2-[4-(4-ブチルシクロヘキシル) ブチル) - 1, 3-プロパンジオール、<math>2-アミノ-2-[2-(4-オクチルシクロヘキシル) エチル] - 1, 3-プロパンジオール、<math>2-アミノ-2-[2-(4-J)-2-1] - 1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-[2-(4-Fデシルシクロヘキシル) エチル] - 1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(24)の2-アミノ-1,3-プロパンジオールから選ばれる上記(24)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(26)一般式

$$H_2N \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OH$$
 R_n
(I-17)

〔式中、Rn はアルキル部の炭素数の総計が6~20個である1-アルキル置換 ピペリジン-4-イルアルキルを示す。〕により表される上記(12)の2-ア ミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。 (27)2-アミノー2-〔2-(1-オクチルピペリジン-4-イル)エチル〕 ー1、3-プロパンジオールおよび2-アミノー2-〔2-(1-ドデシルピペ リジン-4-イル)エチル〕-1、3-プロパンジオールから選ばれる上記(26) の2-アミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。 (28)一般式

$$H_2N \xrightarrow{CH_2OH} CH_2OH$$
 (I-18)

〔式中、 R_0 はアルキル部の炭素数が $6\sim20$ 個であるチエニルアルキル、アルキル部の炭素数の総計が $6\sim20$ 個であるアルキル置換チエニルアルキル、アルキル部の炭素数が $6\sim20$ 個であるピリジルアルキルまたはアルキル部の炭素数の総計が $6\sim20$ 個であるアルキル置換ピリジルアルキルを示す。〕により表される上記(12)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(30)一般式

$$\begin{array}{c} CH_2OH \\ H_2N & \stackrel{|}{---} C & CH_2OH \\ R_P & \\ \end{array}$$

〔式中、Rp は炭素数が $6\sim1$ 8個であるアルキルにより置換されたフェニル、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロサイクルを示す。〕により表される上記(1)または(2)の2-rミノー1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(31)一般式

$$H_2N \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OH$$
 (1-20)

〔式中、Rq は炭素数が $6\sim1$ 8個であるアルキルにより置換されたフェニルを示す。〕により表される上記(30)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(32) 2-アミノ-2-(4-デシルフェニル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(4-ドデシルフェニル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(4-テトラデシルフェニル)-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-(4-ヘキサデシルフェニル)-1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(30)または(31)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(33)一般式

$$CH_2OR^4a$$
 $R^2aR^3aN \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OR^5a$
 $CH(OH)R^1$

〔式中、R¹ は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖 {当該鎖

中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N (R^6) - (CCCC, R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいへテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端(ω 位)に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体が置換していてもよい〉または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体を示し、 R^2a 、 R^3a 、 R^4a 、 R^5a は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいへテロアリーレンもしくはその脂環体、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコ

キシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。」により表される上記(1)または(2)の2-アミノ-1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。(34)一般式

〔式中、Rr は鎖中に二重結合またはカルボニルを有していてもよく、また水酸基および/またはヒドロキシイミノにより置換されていてもよいアルキルを示す。〕により表される上記(33)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(35) 2 - アミノー2 - (1, 2, 12 - トリヒドロキシー4 - オクタデセニル) - 1, 3 - プロパンジオール、2 - アミノー2 - (1, 2 - ジヒドロキシー4 - オクタデセニル) - 1, 3 - プロパンジオール、2 - アミノー2 - (1, 2 - ジヒドロキシオクタデシル) - 1, 3 - プロパンジオール、2 - アミノー2 - (1, 12 - ジヒドロキシー4 - オクタデセニル) - 1, 3 - プロパンジオール、2 - アミノー2 - (1, 12 - ジヒドロキシー4 - オクタデセニル) - 1, 3 - プロパンジオール、2 - アミノー2 - (1, 2, 12 - トリヒドロキシオクタデシル) - 1, 3 - プロパンジオールおよび2 - アミノー2 - (1, 12 - ジヒドロキシオクタデシル) - 1, 3 - プロパンジオールから選ばれる上記(33)または(34)の2 - アミノー1, 3 - プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。(36) - 般式

(式中、Rs はハロゲンで置換されていてもよい炭素数6~14個の直鎖もしく

は分枝鎖状のアルキル、ハロゲンで置換されていてもよい炭素数 $6 \sim 14$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシまたは炭素数 $6 \sim 14$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシにより置換されたフェニルアルキルを示す。)により表される上記(33)の2-7ミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(37) 2 - アミノー 2 - 〔1 - ヒドロキシー 2 - 〔4 - オクチルフェニル)エチル〕-1, 3 - プロパンジオール、2 - アミノー 2 - 〔2 - 〔4 - ドデシルフェニル)-1 - ヒドロキシエチル〕-1, 3 - プロパンジオール、2 - アミノー 2 - 〔2 - 〔4 - ヘプチルオキシフェニル)-1 - ヒドロキシエチル〕-1, 3 - プロパンジオール、2 - アミノー2 - 〔1 - ヒドロキシー2 - 〔4 - ウンデシルオキシフェニル)エチル〕-1, 3 - プロパンジオール、2 - アミノー2 - 〔2 - 〔4 - 〕 4 - 4

(38) 一般式

$$CH_2OR^4a$$
 $R^2aR^3aN \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OR^5a$
 $CH = CHRt$
 $CH = CHRt$

(式中、Rt は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖 {当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、−N (R⁶) − (ここで、R⁶ は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を

有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよい または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体を示し、 R^2a 、 R^3a 、 R^4a 、 R^5a は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。」により表される上記(1)または(2)の2-アミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(39)一般式

$$CH_2OH$$
 $H_2N \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OH$
 $CH = CHRU$
 $(1-25)$

〔式中、Ru は炭素数が $4 \sim 1$ 6 個であるアルキルにより置換されたフェニルを示す。〕により表される上記(38)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(40) 2-r = 1-2-(2-(4-t)+1) = 1, 3 $- \pi = 1$ $- \pi =$

(41)一般式

$$CH_2OR^4a$$
 $R^2aR^3aN \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OR^5a$
 $(CH_2)\alpha X(CH_2)BRv$

(I-26)

〔式中、Rv は置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体を示し、R²a、R³a、R⁴a、R⁵aは同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示し、Xは酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N (R°) - (ここで、R°は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)を示し、 α 、 β は0または $1\sim2$ 0の整数(但し、 $\alpha+\beta$ は $5\sim2$ 0である)を示す。

また、上記置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシ クロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環

体は、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。)により表される上記(1)または(2)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(42) 一般式

$$CH_2OH$$
 $H_2N \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OH$
 CH_2ORw
 $(I-27)$

〔式中、Rw は炭素数が $4 \sim 16$ 個であるアルキルにより置換されたフェニルを示す。〕により表される上記(41)の2-アミノー1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(43) 2 - アミノー2 - (4 - オクチルフェノキシメチル) - 1, 3 - プロパンジオール、2 - アミノー2 - (4 - デシルフェノキシメチル) - 1, 3 - プロパンジオール、2 - アミノー2 - (4 - ドデシルフェノキシメチル) - 1, 3 - プロパンジオールおよび2 - アミノー2 - (4 - テトラデシルフェノキシメチル) - 1, 3 - プロパンジオールから選ばれる上記(41)または(42)の2 - アミノー1, 3 - プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(44)上記(1)~(4)のいずれかの化合物を含有してなる医薬組成物。(45)一般式

$$R^{2}R^{3}N \xrightarrow{C} CH_{2}OR^{5} \qquad (I-28)$$

$$R^{2}R^{3}N \xrightarrow{R}$$

〔式中、Rは置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖 {当該鎖中

に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R^6)-(ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体が置換していてもよい)または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいアロアリールもしくはその脂環体を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 がアルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示すか、 R^4 、 R^5 がアルキル、アリールまたはアラルキルにより置換されていてもよいアルキレン鎖により結合していてもよい。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハ

ロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。 さらに、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。〕により表される2-アミノ-1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩を含有してなる免疫抑制剤。

- (46)上記(1)~(43)のいずれかに記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩を含有してなる免疫抑制剤。
- (47)免疫抑制剤が拒絶反応抑制剤である上記(45)または(46)の薬剤。
- (48)免疫抑制剤が自己免疫疾患の予防または治療薬である上記(45)または(46)の薬剤。
- (49) 自己免疫疾患の予防または治療薬がリウマチの予防または治療薬である 上記(48)の薬剤に関する。

本明細書における各記号で表される基について以下に説明する。

R、 R^1 、 R^1 a、Rt における炭素鎖とは、炭素数 $1 \sim 30$ 個の直鎖または分枝鎖状の炭素鎖であり、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソプチル、第 3 級プチル、ペンチル、イソペンチル、第 3 級ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシル、ノナデシル、イコシル、ヘンイコシル、ドコシル、トリコシル、テトラコシル、ペンタコシル、ヘキサコシル、ヘプタコシル、オクタコシル、ノナコシル、トリアコンチル等があげられる。

R、 R^1 、Rt におけるアリーレンとは、フェニレン、ナフチレン等があげら

れる。好ましくはフェニレンである。

R、 R^1 、 R^1 a、Rt におけるシクロアルキレンとは、炭素数 $3\sim 10$ 個のシクロアルキレンであって、例えば、シクロプロピレン、シクロブチレン、シクロペンチレン、シクロヘキシレン、シクロヘプチレン、シクロオクチレン、シクロノニレン、シクロデシレン等があげられる。好ましくは、シクロヘキシレンである。

R、R¹、Rtにおけるヘテロアリーレンは1~2個のヘテロ原子(窒素原子、酸素原子、硫黄原子から選ばれる)を環中に含んでいてもよい5~6 員のヘテロアリーレンであって、たとえば、チオフェンー(2、4 -、2、5 - または3、4 -)イレン、フランー(2、4 -、2、5 - または3、4 -)イレン、ピロールー(1、3 -、2、4 - 、2、5 - または3、4 -)イレン、イミダゾールー(1、4 -、2、4 - または2、5 -)イレン、チアゾールー(2、4 - または2、5 -)イレン、チアゾールー(2、4 - または2、5 -)イレン、イソチアゾールー(3、4 - または3、5 -)イレン、オキサゾールー(2、4 - または2、5 -)イレン、イソオキサゾールー(3、4 - または3、5 -)イレン、ピリジンー(2、4 - 、2、5 - 、2、6 - または3、5 -)イレン、ピリジンー(2、4 - 、2、5 - 、2・6 - または3、5 -)イレン、ピリダジンー(3、5 - または3、6 -)イレン、ピラジンー 2、5 - イレン、ピリグンー 2、5 - または2、6 -)イレン等があげられる。好ましくはチオフェンー2、5 - イレン、ピリジンー 2、5 - イレンである。

R、R¹、Rtにおける上記へテロアリーレンの脂環体は、上記へテロアリーレンが飽和されているものであって、たとえば、ピロリジンー(1, 3-、2, 4-、2, 5-または3, 4-) イレン、ピペリジンー(1, 4-、2, 4-、2, 5-、2, 6-または3, 5-) イレン、ピペラジンー1, 4-イレン、モルホリン-2, 4または3, 4-イレン、チオモルホリン-2, 4または3, 4-イレン等があげられる。

R、 R^1 、Rt 、Rv におけるアリールとは、フェニル、ナフチル等があげられる。好ましくはフェニルである。

R、R¹、R¹a、R¹b、Rp、Rt、Rvにおけるシクロアルキルとは、炭素

数 3~10個のシクロアルキルであって、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル等があげられる。好ましくはシクロヘキシルである。

R、R¹、Rp、Rt、Rv におけるヘテロアリールは1~4個のヘテロ原子 (窒素原子、酸素原子、硫黄原子から選ばれる)を環中に含んでいてもよい5~ 6員のヘテロアリールであって、たとえば、チエニル(2-チエニル、3-チエ ニル)、フリル(2-フリル、3-フリル)、ピロリル(1-ピロリル、2-ピ ロリル、3-ピロリル)、イミダブリル(2-イミダブリル、4-イミダブリル 等)、ピラゾリル(3-ピラゾリル、4-ピラゾリル等)、トリアゾリル、テド ラゾリル、チアゾリル(2-チアゾリル、4-チアゾリル等)、イソチアゾリル (3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル等)、オキサゾリル(2-オキサゾ リル、4-オキサゾリル等)、イソオキサゾリル(3-イソオキサゾリル、4-イソオキサブリル等)、ピリジル(2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル)、 ピラジニル、ピリミジニル(2-ピリミジニル、4-ピリミジニル等)、ピリダ ジニル(3-ピリダジニル、4-ピリダジニル等)、ピラニル(2-ピラニル、 3-ピラニル、4-ピラニル)等の単環式へテロアリール、インドリル(2-イ ンドリル、3-インドリル)、キノリル(2-キノリル、3-キノリル)、イソ キノリル(1-イソキノリル、3-イソキノリル)、ベンゾフラニル(2-ベン ゾフラニル、3-ベンゾフラニル)、ベンゾチエニル(2-ベンゾチエニル、3 ーベンゾチエニル)、1H-ベンズイミダゾール-2-イル、クロメニル(2-クロメニル、3-クロメニル、4-クロメニル)等の二環式へテロアリール等が あげられる。

R、 R^1 、Rt 、Rt における上記へテロアリールの脂環体は、上記単環式へテロアリールが飽和されているものであって、たとえば、ピロリジニル(1-ピロリジニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル)、ピペリジル(2-ピペリジル、3-ピペリジル、4-ピペリジル)、ピペリジノ、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル等があげられる。

Rp におけるヘテロサイクルとは、ヘテロアリールの脂環体を示す。

R¹b、Rr におけるアルキルとは、炭素数1~30個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソプチル、第3級プチル、ペンチル、イソペンチル、第3級ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシル、ノナデシル、イコシル、ヘンイコシル、ドコシル、トリコシル、テトラコシル、ペンタコシル、ヘキサコシル、ヘプタコシル、オクタコシル、ノナコシル、トリアコンチル等があげられる。

Ra における炭素数 $12 \sim 22$ 個の直鎖または分枝鎖状のアルキル、Rb、Rc における炭素数 $13 \sim 20$ 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルとは、上記アルキルの所定の炭素数のものを示す。

R¹bにおけるアルケニルとは、炭素数 2~30個の直鎖または分枝鎖状のアルケニルであって、例えば、エテニル、プロペニル、イソプロペニル、ブテニル、イソプテニル、ペンテニル、イソペンテニル、ヘキセニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル、デセニル、ウンデセニル、ドデセニル、トリデセニル、テトラデセニル、ペンタデセニル、ヘキサデセニル、ヘプタデセニル、オクタデセニル、ノナデセニル、イコセニル、ヘンイコセニル、ドコセニル、トリコセニル、テトラコセニル、ペンタコセニル、ヘキサコセニル、ヘプタコセニル、オクタコセニル、ノナコセニル、トリアコンテニル等があげられる。

 R^1b におけるアルキニルとは、炭素数 $2 \sim 3$ 0 個の直鎖または分枝鎖状のアルキニルであって、例えば、エチニル、プロピニル、イソプロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニニル、デシニル、ウンデシニル、ドデシニル、トリデシニル、テトラデシニル、ペンタデシニル、ヘキサデシニル、ヘプタデシニル、オクタデシニル、ノナデシニル、イコシニル、ヘンイコシニル、ドコシニル、トリコシニル、テトラコシニル、ペンタコシニル、ヘキサコシニル、ヘプタコシニル、オクタコシニル、ノナコシニル、トリアコンチニル等があげられる。

Rd、Re、Rf、Rg、Ri、Rk、Rs におけるフェニルアルキルとは、

アルキル部の炭素数が1~30個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを有するフェニルアルキルであって、例えば、ベンジル、1-フェニルエチル、2-フェニルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、4-フェニルプチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、7-フェニルヘプチル、8-フェニルオクチル、9-フェニルノニル、10-フェニルデシル、<math>11-フェニルウンデシル、12-フェニルドデシル、13-フェニルトリデシル、<math>14-フェニルテトラデシル、15-フェニルペンタデシル、16-フェニルへキサデシル、17-フェニルヘプタデシル、18-フェニルオクタデシル、19-フェニルノナデシル、20-フェニルイコシル、21-フェニルヘンイコシル、22-フェニルドコシル、23-フェニルトリコシル、24-フェニルテトラコシル、25-フェニルペンタコシル、26-フェニルへキサコシル、27-フェニルへプタコシル、28-フェニルオクタコシル、29-フェニルノナコシル、30-フェニルトリアコンチル等があげられる。

Re、Rf、Rg、Rhにおけるアルキル部の炭素数が $6\sim20$ 個であるフェニルアルキル、Rj、Rlにおけるアルキル部が炭素数 $2\sim6$ 個のアルキルであるフェニルアルキルとは、上記フェニルアルキルの所定の炭素数のものを示す。

Rh におけるアルキル部およびアルコキシ部の炭素数の総計が $6 \sim 20$ 個であるフェニルアルコキシアルキルとは、例えば、5 - フェニルメチルオキシペンチル、6 - フェニルメチルオキシへキシル、7 - フェニルメチルオキシへプチル、8 - フェニルメチルオキシテシル、12 - フェニルメチルオキシデシル、14 - フェニルメチルオキシデシル、14 - フェニルメチルオキシテトラデシル、16 - フェニルメチルオキシヘキサデシル、18 - フェニルメチルオキシオクタデシル、2 - (8 - フェニルオクチルオキシ) エチル、3 - (8 - フェニルオクチルオキシ) プロピル、4 - (8 - フェニルオクチルオキシ) プチルオキシ) プチルオキシ) プチルオキシ) プチルオキシ) ペンチル、6 - (8 - フェニルオクチルオキシ) ヘキシル、7 - (8 - フェニルオクチルオキシ) ヘプチル等のフェニルアルコキシアルキル等があげられる。

Rh におけるアルキル部の炭素数が6~20個であるフェノキシアルキルとは、

例えば、6-フェノキシヘキシル、7-フェノキシヘプチル、<math>8-フェノキシオクチル、9-フェノキシノニル、10-フェノキシデシル、11-フェノキシウンデシル、12-フェノキシドデシル、13-フェノキシトリデシル、14-フェノキシテトラデシル、<math>15-フェノキシペンタデシル、16-フェノシキヘキサデシル、17-フェノキシヘプタデシル、18-フェノキシオクタデシル、19-フェノキシノナデシル、20-フェノキシイコシル等があげられる。

Rd、Re、Rf、Rgにおけるシクロアルキルアルキルとは、アルキル部の 炭素数が $1 \sim 3$ 0 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、シクロアルキル 部の炭素数が $3 \sim 1$ 0 個のシクロアルキルを有するものであって、例えば、シクロヘキシルメチル、1-シクロヘキシルエチル、2-シクロヘキシルエチル、1-シクロヘキシルプロピル、3-シクロヘキシルプロピル、3-シクロヘキシルプロピル、4-シクロヘキシルブチル、5-シクロヘキシルペンチル、6-シクロヘキシルヘキシル、7-シクロヘキシルヘプチル、8-シクロヘキシルオクチル、9-シクロヘキシルノニル、10-シクロヘキシルデシル、11-シクロヘキシルトリデシル、14-シクロヘキシルテトラデシル、15-シクロヘキシルペンタデシ

ル、16-シクロヘキシルヘキサデシル、17-シクロヘキシルヘプタデシル、 $18-\upsilon$ クロヘキシルオクタデシル、 $19-\upsilon$ クロヘキシルノナデシル、 $20-\upsilon$ クロヘキシルイコシル、 $21-\upsilon$ クロヘキシルヘンイコシル、 $22-\upsilon$ クロヘキシルドコシル、 $23-\upsilon$ クロヘキシルトリコシル、 $24-\upsilon$ クロヘキシルテトラコシル、 $25-\upsilon$ クロヘキシルペンタコシル、 $26-\upsilon$ クロヘキシルヘキサコシル、 $27-\upsilon$ クロヘキシルヘプタコシル、 $28-\upsilon$ クロヘキシルオクタコシル、 $29-\upsilon$ クロヘキシルノナコシル、 $30-\upsilon$ クロヘキシルトリアコンチル等があげられる。

Re、Rf、Rg におけるアルキル部の炭素数が $6 \sim 20$ 個であるシクロアルキルアルキルとは、上記シクロアルキルアルキルの所定の炭素数のものを示す。

Rm におけるアルキル部の炭素数の総計が $6 \sim 20$ 個であるアルキル置換シクロアルキルアルキルとは、例えば、 $3 - (4 - \wedge)$ チルシクロヘキシル)プロピル、4 - (4 -) チルシクロヘキシル)ブチル、2 - (4 -) ナルシクロヘキシル)エチル、2 - (4 -) デシルシクロヘキシル)エチル、2 - (4 -) デシルシクロヘキシル)エチル等があげられる。

Rd、Re、Rf、Rgにおけるヘテロアリールアルキルとは、アルキル部の 炭素数が $1 \sim 3$ 0 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを有するヘテロアリールアルキルであって、例えば、(チエニルまたはピリジル)メチル、1-(チエニルまたはピリジル)エチル、1-(チエニルまたはピリジル)エチル、1-(チエニルまたはピリジル)プロピル、2-(チエニルまたはピリジル)プロピル、3-(チエニルまたはピリジル)プロピル、4-(チエニルまたはピリジル)ブチル、5-(チエニルまたはピリジル)ペンチル、6-(チエニルまたはピリジル)ペナシル、7-(チエニルまたはピリジル)ヘプチル、8-(チエニルまたはピリジル)トリジル)オクチル、9-(チエニルまたはピリジル)ノニル、10-(チエニルまたはピリジル)ナンテシル、12-(チエニルまたはピリジル)デシル、13-(チエニルまたはピリジル)トリデシル、14-(チエニルまたはピリジル)テトラデシル、15-(チエニルまたはピリジル)ペンタデシル、16-(チエニルまたはピリジル)ヘキサデシ

ル、17-(チエニルまたはピリジル)へプタデシル、18-(チエニルまたはピリジル)オクタデシル、19-(チエニルまたはピリジル)ノナデシル、20-(チエニルまたはピリジル)イコシル、21-(チエニルまたはピリジル)へンイコシル、22-(チエニルまたはピリジル)ドコシル、23-(チエニルまたはピリジル)トリコシル、24-(チエニルまたはピリジル)テトラコシル、25-(チエニルまたはピリジル)ペンタコシル、26-(チエニルまたはピリジル)へキサコシル、27-(チエニルまたはピリジル)へプタコシル、28-(チエニルまたはピリジル)オクタコシル、29-(チエニルまたはピリジル)ノナコシル、30-(チエニルまたはピリジル)トリアコンチル等のチエニルアルキルまたはピリジルアルキルがあげられる。

Re、Rf、Rg におけるアルキル部の炭素数が $6 \sim 20$ 個のヘテロアリールアルキルとは、上記ヘテロアリールアルキルの所定の炭素数のものを示す。

 R_0 におけるアルキル部の炭素数の総計が $6 \sim 20$ 個であるアルキル置換チエニルアルキルとは、例えば、2 - (5 - オクチル - 2 - チェニル) エチル、2 - (5 - J - L) エチル、2 - (5 - F) エチル・2 - F エニル)エチル等があげられる。

 R_0 におけるアルキル部の炭素数が $6 \sim 20$ 個であるチエニルアルキルとは、上記へテロアリールアルキルのうちのチエニルアルキルを示す。好ましくは 13 -(2-チェニル) トリデシル等である。

 R_0 におけるアルキル部の炭素数の総計が $6 \sim 20$ 個であるアルキル置換ピリジルアルキルとは、例えば、2-(5-オクチル-2-ピリジル) エチル、2-(5-デシル-2-ピリジル) エチル、2-(2-オクチル-5-ピリジル) エチル、2-(2-デシル-5-ピリジル) エチル、2-(2-デシル-5-ピリジル) エチル等があげられる。

Rd、Re、Rf 、Rg におけるヘテロサイクリックアルキルとは、アルキル部の炭素数が $1\sim30$ 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、ヘテロサイ

クリックとは、ヘテロアリールの脂環体であるヘテロサイクリックアルキルであ って、例えば、4-ピペリジルメチル、1-(4-ピペリジル)エチル、2-(4-ピペリジル)エチル、1-(4-ピペリジル)プロピル、2-(4-ピペリ ジル)プロピル、3-(4-ピペリジル)プロピル、4-(4-ピペリジル)ブ チル、5-(4-ピペリジル)ペンチル、6-(4-ピペリジル)ヘキシル、7 - (4-ピペリジル) ヘプチル、8-(4-ピペリジル) オクチル、9-(4-ピペリジル) ノニル、10-(4-ピペリジル)デシル、11-(4-ピペリジ ル) ウンデシル、12-(4-ピペリジル)ドデシル、13-(4-ピペリジル) トリデシル、14-(4-ピペリジル)テトラデシル、15-(4-ピペリジル) ペンタデシル、16- (4-ピペリジル) ヘキサデシル、17- (4-ピペリジ ル) ヘプタデシル、18-(4-ピペリジル) オクタデシル、19-(4-ピペ リジル) ノナデシル、20-(4-ピペリジル) イコシル、21-(4-ピペリ ジル)ヘンイコシル、22-(4-ピペリジル)ドコシル、23-(4-ピペリ ジル)トリコシル、24-(4-ピペリジル)テトラコシル、25-(4-ピペ リジル)ペンタコシル、26-(4-ピペリジル)ヘキサコシル、27-(4-ピペリジル)ヘプタコシル、28-(4-ピペリジル)オクタコシル、29-(4-ピペリジル) ノナコシル、30-(4-ピペリジル) トリアコンチル等があ げられる。

Re、Rf、Rg におけるアルキル部の炭素数が $6 \sim 20$ 個のヘテロサイクリックアルキルとは、上記ヘテロサイクリックアルキルの所定の炭素数のものを示す。

Rn におけるアルキル部の炭素数の総計が $6 \sim 20$ 個である1 -アルキル置換 ピペリジン-4 -イルアルキルとは、例えば、2 - (1 -オクチルピペリジン-4 -イル)エチル、2 - (1 -ドデシルピペリジン-4 -イル)エチル等があげられる。

R、 R^1b 、Rd 、Rm 、Rn 、Ro 、Rv における置換基としてのアルキルとは、炭素数 $1\sim 2$ 0 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、メチル、エチル、プロピル、プチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノ

ニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシル、ノナデシル、イコシル等があげられる。

Re、Rf における置換基としての炭素数 $6\sim2$ 0 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、Rg、Ri、Rj、Rs における置換基としての炭素数 $6\sim1$ 4 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、Rp、Rq における置換基としての炭素数が $6\sim1$ 8 個であるアルキル、Ru、Rw における置換基としての炭素数が $4\sim1$ 6 個であるアルキルとは、上記アルキルの所定の炭素数のものを示す。

R、 R^1 、 R^1 a、 R^1 b、Ra 、Rd 、Re 、Rf 、Rt 、Rv における置換基としてのアルコキシとは、炭素数 $1\sim 2$ 0 個の直鎖または分枝鎖状のアルコキシであって、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、第 2 級ブトキシ、第 3 級ブトキシ、ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、第 3 級ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヘプチルオキシ、オクチルオキシ、ノニルオキシ、デシルオキシ、ウンデシルオキシ、ドデシルオキシ、トリデシルオキシ、テトラデシルオキシ、ペンタデシルオキシ、ヘキサデシルオキシ、ヘプタデシルオキシ、オクタデシルオキシ、ノナデシルオキシ、イコシルオキシ等があげられる。

Re、Rf における置換基としての炭素数 $6\sim20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシ、Rg、Ri、Rj、Rs における置換基としての炭素数 $6\sim14$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシとは、上記アルコキシの所定の炭素数のものを示す。

R、 R^1 、 R^1 a、 R^1 b、Ra 、Rd 、Re 、Rf 、Rt 、Rv における置換基としてのアルケニルオキシとは、そのアルケニル部が炭素数 $2\sim 2$ 0 個の直鎖または分枝鎖状のアルケニルであって、例えば、ビニルオキシ、プロペニルオキシ、イソプロペニルオキシ、ブテニルオキシ、イソブテニルオキシ、ペンテニルオキシ、イソペンテニルオキシ、ヘキセニルオキシ、ヘプテニルオキシ、オクテニルオキシ、ノネニルオキシ、デセニルオキシ、ウンデセニルオキシ、ドデセニルオキシ、トリデセニルオキシ、テトラデセニルオキシ、ペンタデセニルオキシ、ヘ

キサデセニルオキシ、ヘプタデセニルオキシ、オクタデセニルオキシ、ノナデセニルオキシ、イコセニルオキシ等があげられる。

Re、Rf における置換基としての炭素数 $6\sim20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、Rg、Ri、Rj、Rs における置換基としての炭素数 $6\sim14$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシとは、上記アルケニルオキシの所定の炭素数のものを示す。

R、 R^1 、 R^1 a、 R^1 b、Ra 、Rd 、Re 、Rf 、Rt 、Rv における置換基としてのアルキニルオキシとは、そのアルキニル部が炭素数 $2 \sim 20$ 個の直鎖または分枝鎖状のアルキニルであって、例えば、エチニルオキシ、プロピニルオキシ、ブチニルオキシ、ペンチニルオキシ、ヘキシニルオキシ、ヘプチニルオキシ、オクチニルオキシ、ノニニルオキシ、デシニルオキシ、ウンデシニルオキシ、ドデシニルオキシ、トリデシニルオキシ、テトラデシニルオキシ、ペンタデシニルオキシ、トリデシニルオキシ、ヘプタデシニルオキシ、オクタデシニルオキシ、ノナデシニルオキシ、イコシニルオキシ等があげられる。

R、R¹、R¹a、R¹b、Ra、Rd、Re、Rf、Rt、Rvにおける置換基としてのアラルキルオキシにおけるアラルキルとは、アルキル部が炭素数 $1 \sim 2$ 0個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであるアラルキルであって、例えば、ベンジルオキシ、2 - 7 エネチルオキシ、1 - 7 エニルズロピルオキシ、2 - 7 エニルプロピルオキシ、3 - 7 エニルプロピルオキシ、4 - 7 エニルブチルオキシ、5 - 7 エニルペンチルオキシ、6 - 7 エニルヘキシルオキシ、7 - 7 エニルペプチルオキシ、8 - 7 エニルオクチルオキシ、9 - 7 エニルノニルオキシ、10 - 7 エニルデシルオキシ、11 - 7 エニルウンデシルオキシ、12 - 7 エニルドデシルオキシ、13 - 7 エニルトリデシルオキシ、14 - 7 エニルテトラデシルオキシ等のフェニルアルコキシ、ナフチルメチル、14 - 7 エニルテトラデシルオキシ等のフェニルアルコキシ、カリテルメチル、14 - 7 エニルテトラデシルオキシ等のフェニルアルコキシである。

Re、Rf、Rg、Rkにおける置換基としてのフェニルアルコキシとは、上 記アラルキルオキシにおけるフェニルアルコキシを示す。

R1 における置換基としてのアルコキシ部の炭素数が $2 \sim 8$ 個であるフェニルアルコキシとは、上記アラルキルオキシにおけるフェニルアルコキシの所定の炭素数のものを示す。

R、 R^1 、 R^1 a、Rd 、Rt 、Rv における置換基としてのアルキレンジオキシとは、そのアルキレン部が炭素数 $1 \sim 2$ 0 個の直鎖または分枝鎖状のアルキレンであるアルキレンジオキシであって、例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、プロピレンジオキシ、トリメチレンジオキシ、プチレンジオキシ、1, 2-ジメチルエチレンジオキシ、ペンタメチレンジオキシ、ヘキサメチレンジオキシ、ベプタメチレンジオキシ、カクタメチレンジオキシ、ノナメチレンジオキシ、デカメチレンジオキシ、ウンデカメチレンジオキシ、ドデカメチレンジオキシ、トリデカメチレンジオキシ、テトラデカメチレンジオキシ、ペンタデカメチレンジオキシ、ヘキサデカメチレンジオキシ、ヘプタデカメチレンジオキシ、オクタデカメチレンジオキシ、ノナデカメチレンジオキシ、イコサメチレンジオキシ等があげられる。好ましくはメチレンジオキシ、エチレンジオキシ等である。

R、R¹a、R¹a、R¹b、Ra、Rd、Re、Rf、Rt、Rvにおける置換基としてのアシルとは置換基を有していてもよいアルカノイルあるいはアロイルを意味し、アルカノイルとは炭素数1~20個の直鎖または分枝鎖状のアルカノイルであって、例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、オクタノイル、ノナノイル、デカノイル、ウンデカノイル、ドデカノイル、トリデカノイル、テトラデカノイル、ペンタデカノイル、ヘキサデカノイル、ヘプタデカノイル、オクタデカノイル、ノナデカノイル、イコサノイル等があげられ、また、これらは置換基としてフェニルを有していてもよく、例えばフェニルアセチル、フェニルプロピオニル等があげられる。また、アロイルとしてはベンゾイル等があげられる。

R、 R^1 、 R^1 a、 R^1 b、Ra 、Rd 、Re 、Rf 、Rt 、Rv における置換基としてのアルキルアミノとは、そのアルキル部が炭素数 $1 \sim 20$ 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ、第 2 級ブチル

アミノ、第3級プチルアミノ、ペンチルアミノ、イソペンチルアミノ、第3級ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ヘプチルアミノ、オクチルアミノ、ノニルアミノ、デシルアミノ、ウンデシルアミノ、ドデシルアミノ、トリデシルアミノ、テトラデシルアミノ、ペンタデシルアミノ、ヘキサデシルアミノ、ヘプタデシルアミノ、オクタデシルアミノ、ノナデシルアミノ、イコシルアミノ等があげられる。

R、 R^1 、 R^1 a、 R^1 b、Ra 、Rd 、Re 、Rf 、Rt 、Rv における置換基としてのアルキルチオとは、そのアルキル部が炭素数 $1\sim 20$ 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソプチルチオ、第 2 級ブチルチオ、第 3 級ブチルチオ、ペンチルチオ、イソペンチルチオ、第 3 級ペンチルチオ、ヘキシルチオ、ヘプチルチオ、オクチルチオ、ノニルチオ、デシルチオ、ウンデシルチオ、ドデシルチオ、トリデシルチオ、テトラデシルチオ、ペンタデシルチオ、ヘキサデシルチオ、ヘプタデシルチオ、オクタデシルチオ、ノナデシルチオ、イコシルチオ等があげられる。

R、 R^1 、 R^1 a、 R^1 b、Ra 、Rd 、Re 、Rf 、Rt 、Rv における置換基としてのアシルアミノとは、そのアシル部が炭素数 $1 \sim 20$ 個の直鎖または分枝鎖状のアルカノイルであって、例えば、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、ピバロイルアミノ、ヘキサノイルアミノ、ヘプタノイルアミノ、オクタノイルアミノ、ナノイルアミノ、デカノイルアミノ、ウンデカノイルアミノ、ドデカノイルアミノ、トリデカノイルアミノ、テトラデカノイルアミノ、ペンタデカノイルアミノ、ヘキサデカノイルアミノ、ヘプタデカノイルアミノ、オクタデカノイルアミノ、ノナデカノイルアミノ、イコサノイルアミノ等があげられる。

R、 R^1 、 R^1 a、 R^1 b、Ra 、Rd 、Re 、Rf 、Rt 、Rv における置換基としてのアルコキシカルボニルとは、そのアルコキシ部が炭素数 $1 \sim 20$ 個の直鎖または分枝鎖状で、置換基を有していてもよいアルコキシであって、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソプトキシカルボニル、第 3 級プトキ

シカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、イソペンチルオキシカルボニル、第 3級ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、ヘプチルオキシカルボニル、オクチルオキシカルボニル、ノニルオキシカルボニル、デシルオキシカルボニル、トリデシルオキシカルボニル、テトラデシルオキシカルボニル、ペンタデシルオキシカルボニル、マサデシルオキシカルボニル、ヘプタデシルオキシカルボニル、オクタデシルオキシカルボニル、ノナデシルオキシカルボニル、イコシルオキシカルボニル、オカタデシルオキシカルボニル、ノナデシルオキシカルボニル、イコシルオキシカルボニル等があげられ、また、これらは置換基としてフェニルを有していてもよく、例えばベンジルオキシカルボニル等があげられる。

R、R¹、R¹a、R¹b、Ra、Rd、Re、Rf、Rt、Rvにおける置換基 としてのアルコキシカルボニルアミノとは、そのアルコキシ部が炭素数1~20 個の直鎖または分枝鎖状で、置換基を有していてもよいアルコキシであって、例 えば、メトキシカルボニルアミノ、エトキシカルボニルアミノ、プロポキシカル ボニルアミノ、イソプロポキシカルボニルアミノ、プトキシカルボニルアミノ、 イソブトキシカルボニルアミノ、第3級ブトキシカルボニルアミノ、ペンチルオ キシカルボニルアミノ、イソペンチルオキシカルボニルアミノ、第3級ペンチル オキシカルボニルアミノ、ヘキシルオキシカルボニルアミノ、ヘプチルオキシカ ルボニルアミノ、オクチルオキシカルボニルアミノ、ノニルオキシカルボニルア ミノ、デシルオキシカルボニルアミノ、ウンデシルオキシカルボニルアミノ、ド **デシルオキシカルボニルアミノ、トリデシルオキシカルボニルアミノ、テトラデ** シルオキシカルボニルアミノ、ペンタデシルオキシカルボニルアミノ、ヘキサデ シルオキシカルボニルアミノ、ヘプタデシルオキシカルボニルアミノ、オクタデ シルオキシカルボニルアミノ、ノナデシルオキシカルボニルアミノ、イコシルオ キシカルボニルアミノ等があげられ、また、これらは置換基としてフェニルを有 していてもよく、例えばベンジルオキシカルボニルアミノ等があげられる。

R、 R^1 、 R^1 a、 R^1 b、Ra 、Rd 、Re 、Rf 、Rt 、Rv における置換基としてのアシルオキシとは、そのアシル部が炭素数 $2\sim 2$ 0 個の直鎖または分枝鎖状のアルカノイルであって、例えば、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチ

リルオキシ、イソプチリルオキシ、ピバロイルオキシ、ペンタノイルオキシ、ヘキサノイルオキシ、ヘプタノイルオキシ、オクタノイルオキシ、ノナノイルオキシ、デカノイルオキシ、ウンデカノイルオキシ、ドデカノイルオキシ、トリデカノイルオキシ、テトラデカノイルオキシ、ペンタデカノイルオキシ、ヘキサデカノイルオキシ、ヘプタデカノイルオキシ、オクタデカノイルオキシ、ノナデカノイルオキシ、イコサノイルオキシ等があげられる。

R、 R^1 、 R^1 a、 R^1 b、Ra 、Rd 、Re 、Rf 、Rt 、Rv における置換基としてのアルキルカルバモイルとは、そのアルキル部が炭素数 $1 \sim 20$ 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、プロピルカルバモイル、ブチルカルバモイル、ペンチルカルバモイル、ヘナシルカルバモイル、ヘプチルカルバモイル、オクチルカルバモイル、ノニルカルバモイル、デシルカルバモイル、ウンデシルカルバモイル、ドデシルカルバモイル、トリデシルカルバモイル、テトラデシルカルバモイル、ペンタデシルカルバモイル、ヘキサデシルカルバモイル、ヘプタデシルカルバモイル、オクタデシルカルバモイル、ノナデシルカルバモイル、イコシルカルバモイル等があげられる。

R、R¹ 、R¹a、R¹b、Rd、Rt、Rv における置換基としてのハロアルキルとは、そのアルキル部が炭素数 $1 \sim 20$ 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、フルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、パーフルオロエチル、3-クロロプロピル、3-フルオロプロピル、4-クロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、6-クロロヘキシル、6-フルオロヘキシル、7-クロロヘプチル、7-フルオロヘプチル、8-フルオロオクチル、9-フルオロノニル、10-フルオロデシル、11-フルオロウンデシル、12-フルオロドデシル、13-フルオロトリデシル、14-フルオロテトラデシル、15-フルオロペンタデシル、16-フルオロヘキサデシル、17-フルオロヘプタデシル、18-フルオロオクタデシル、19-フルオロノナデシル、20-フルオロイコシル等があげられる。

R、R¹、Rd、Rt、Rvにおける置換基としてのハロアルコキシとは、炭

素数 $1 \sim 20$ 個のハロアルコキシであって、たとえば、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、ブロロメトキシ、ジフロモメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフロエトキシ、ジフロエトキシ、ジフロエトキシ、シークロロエトキシ、シーフルオロエトキシ、シークロロプロポキシ、シーフルオロプロポキシ、シークロロプロポキシ、シークロロプトキシ、シークロログトキシ、シークロロペンチルオキシ、シークロロペンチルオキシ、シークロロペンチルオキシ、シークロロペプチルオキシ、フーフルオロペンチルオキシ、フーフルオロペンチルオキシ、フーフルオロペプチルオキシ、シーフルオロオクチルオキシ、シーフルオロアシルオキシ、カーフルオロデシルオキシ、カーフルオロペンタデシルオキシ、カーフルオロペキサデシルオキシ、カーフルオロペプタデシルオキシ、カーフルオロイフタデシルオキシ、カーフルオロインタデシルオキシ、カーフルオロイフシルオキシ、カーフルオロノナデシルオキシ、カーフルオロイフシルオキシ等があげられる。

R、R¹、R¹a、R¹b、Ra、Rb、Rc、Rd、Re、Rf、Rg、Ri、Rj、Rs、Rt、Rvにおける置換基としてのハロゲンとは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素があげられる。

R、 R^1 、Rt における置換基としてのアリールとしては、フェニル、ナフチル等があげられる。好ましくはフェニルである。

R、 R^1 、R t における置換基としてのアリールオキシとしては、フェノキシ、ナフチルオキシ等があげられる。好ましくはフェノキシである。

R、 R^1 、 R^1 a、 R^1 b、Rt における置換基としてのシクロアルキルとは、炭素数 $3\sim1$ 0 個のシクロアルキルであって、例えば、シクロプロピル、シクロプチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル等があげられる。好ましくはシクロヘキシルである。

R、 R^1 、R t における置換基としてのヘテロアリールは $1 \sim 4$ 個のヘテロ原子 (窒素原子、酸素原子、硫黄原子から選ばれる)を環中に含んでいてもよい $5 \sim 6$ 員のヘテロアリールであって、たとえば、チエニル(2 -チエニル、3 -チ

エニル)、フリル(2-フリル、3-フリル)、ピロリル(1-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル)、イミダブリル(2-イミダブリル、4-イミダブリ ル等)、ピラブリル(3-ピラブリル、4-ピラブリル等)、トリアブリル、テ トラゾリル、チアゾリル(2-チアゾリル、4-チアゾリル等)、イソチアゾリ ル(3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル等)、オキサゾリル(2-オキサ ゾリル、4-オキサゾリル等)、イソオキサゾリル(3-イソオキサゾリル、4 ーイソオキサブリル等)、ピリジル(2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジ ル)、ピラジニル、ピリミジニル(2-ピリミジニル、4-ピリミジニル等)、 ピリダジニル(3-ピリダジニル、4-ピリダジニル等)、ピラニル(2-ピラ ニル、3-ピラニル、4-ピラニル)等の単環式へテロアリール、インドリル(2-インドリル、3-インドリル)、キノリル(2-キノリル、3-キノリル)、 イソキノリル(1-イソキノリル、3-イソキノリル)、ベンゾフラニル(2-ベンゾフラニル、3-ベンゾフラニル)、ベンゾチエニル(2-ベンゾチエニル、 3 - ベンゾチエニル)、1H-ベンズイミダゾール-2-イル、クロメニル(2 ークロメニル、3ークロメニル、4ークロメニル)等の二環式へテロアリール等 があげられる。

R、 R^1 、Rt における置換基としての上記へテロアリールの脂環体は、上記単環式へテロアリールが飽和されているものであって、たとえば、ピロリジニル (1-ピロリジニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル)、ピペリジル(2-ピペリジル、3-ピペリジル、4-ピペリジル)、ピペリジノ、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル等があげられる。

R¹aにおける置換基としての炭素鎖とは、炭素数 1 ~ 3 0 個の直鎖または分枝 鎖状の炭素鎖であり、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチ ル、イソプチル、第 3 級プチル、ペンチル、イソペンチル、第 3 級ペンチル、ヘ キシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデ シル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシ ル、ノナデシル、イコシル、ヘンイコシル、ドコシル、トリコシル、テトラコシ ル、ペンタコシル、ヘキサコシル、ヘプタコシル、オクタコシル、ノナコシル、

トリアコンチル等があげられる。

 R^1b における置換基としてのアルケニルとは、炭素数 $2 \sim 2$ 0 個の直鎖または 分枝鎖状のアルケニルであって、例えば、エテニル、プロペニル、イソプロペニル、ブテニル、イソブテニル、ペンテニル、イソペンテニル、ヘキセニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル、デセニル、ウンデセニル、ドデセニル、トリデセニル、テトラデセニル、ペンタデセニル、ヘキサデセニル、ヘプタデセニル、オクタデセニル、ノナデセニル、イコセニル等があげられる。

R¹bにおける置換基としてのアルキニルとは、炭素数 2~20個の直鎖または分枝鎖状のアルキニルであって、例えば、エチニル、プロピニル、イソプロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニニル、デシニル、ウンデシニル、ドデシニル、トリデシニル、テトラデシニル、ペンタデシニル、ヘキサデシニル、ヘプタデシニル、オクタデシニル、ノナデシニル、イコシニル等があげられる。

ロフェニルアルコキシである。

Re、Rf、Rg、Rkにおける置換基としてのハロフェニルアルコキシとは、 上記ハロアラルキルオキシにおけるハロフェニルアルコキシを示す。

R1 における置換基としてのアルコキシ部の炭素数が2~8個であるハロフェニルアルコキシとは、上記ハロアラルキルオキシにおけるハロフェニルアルコキシの所定の炭素数のものを示す。

Rd における置換基としてのアラルキルオキシアルキルとは、アルキル部およびアラルキルのアルキル部が炭素数 $1 \sim 20$ 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、その両アルキル部の炭素数の総計が $2 \sim 20$ 個であるアラルキルオキシアルキルであって、例えば、フェニルメチルオキシメチル、2 -フェニルエチルオキシメチル、3 -フェニルプロピルオキシメチル、4 -フェニルブチルオキシメチル、5 -フェニルペンチルオキシメチル、6 -フェニルヘキシルオキシメチル、7 -フェニルヘプチルオキシメチル、8 -フェニルイクチルオキシメチル、12 -フェニルノニルオキシメチル、14 -フェニルデシルオキシメチル、12 -フェニルトデシルオキシメチル、14 -フェニルオクタデシルオキシメチル、15 -0フェニルアルコキシアルキル、15 -00フェニルアルコキシアルキル、15 -00フェニルアルコキシアルキル、15 -00フェニルアルコキシアルキル、15 -00フェニルアルコキシアルキルドランルオキシメチル、15 -00フェニルアルコキシアルキルドル、15 -00フェニルアルコキシアルキルアルコキシアルキル等があげられる。好ましくはフェニルアルコキシアルキルである。

Re、Rf、Rg 、Rk における置換基としてのフェニルアルコキシアルキルとは、上記アラルキルオキシアルキルにおけるフェニルアルコキシアルキルを示す。

R1 における置換基としてのアルコキシ部およびアルキル部の総炭素数が $2\sim 8$ 個であるフェニルアルコキシアルキルとは、上記アラルキルオキシアルキルにおけるフェニルアルコキシアルキルの所定の炭素数のものを示す。なお、アルコキシ部およびアルキル部のそれぞれの炭素数は、 $1\sim 7$ 個であって、総炭素数が $2\sim 8$ 個である。

R1 における置換基としてのアルキル部の炭素数が2~8個であるフェノキシアルキルとは、上記フェノキシアルキルの所定の炭素数のものを示す。

Rd、Re、Rf、Rg、Rkにおける置換基としてのフェノキシアルコキシとは、アルコキシ部が炭素数 $1\sim20$ 個の直鎖または分枝鎖状のアルコキシであるフェノキシアルコキシであって、例えば、フェノキシメトキシ、1-フェノキシエチルオキシ、2-フェノキシエチルオキシ、1-フェノキシプロピルオキシ、2-フェノキシプロピルオキシ、3-フェノキシプロピルオキシ、4-フェノキシブロピルオキシ、5-フェノキシペンチルオキシ、6-フェノキシへキシルオキシ、7-フェノキシへプチルオキシ、8-フェノキシオクチルオキシ、9-フェノキシノニルオキシ、10-フェノキシデシルオキシ、11-フェノキシウンデシルオキシ、12-フェノキシドデシルオキシ、13-フェノキシトリデシルオキシ、14-フェノキシテトラデシルオキシ、15-フェノキシペンタデシルオキシ、16-フェノキシへキサデシルオキシ、17-フェノキシへプタデシルオキシ、18-フェノキシオクタデシルオキシ、19-フェノキシノナデシルオキシ、20-フェノキシイコシルオキシ等があげられる。

R1 における置換基としてのアルコキシ部の炭素数が2~8個であるフェノキシアルコキシとは、上記フェノキシアルコキシの所定の炭素数のものを示す。

 R^2 、 R^2a 、 R^2b 、 R^2c 、 R^3 、 R^3a 、 R^3b 、 R^3c 、 R^4 、 R^4a 、 R^4b 、 R^5 、 R^5a 、 R^5b 、 R^6 におけるアルキルとは、炭素数 $1\sim 2$ 0 個のアルキルであり、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、第 3 級プチル、ペンチル、イソペンチル、第 3 級ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシル、ノナデシル、イコシル等があげられる。

 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 におけるアラルキルとは、アルキル部の炭素数が1~20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを有するアラルキルであって、例えば、ベンジル、1-フェニルエチル、2-フェニルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、4-フェニルプチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、7-フェニルへプチル、8-フェニルオクチル、9-フェニルノニル、10-フェニルデシル、11-フェニルウンデシル、12-フェニルドデシル、13-フェニルトリデシル、14-フェニルトラデシル、15-フェニルペンタデシル、16-フェニルヘキサデシル、17-フェニルへプタデシル、18-フェニルオクタデシル、19-フェニルノナデシル、20-フェニルイコシル等があげられる。

R²、R²a、R²b、R³、R³a、R³b、R⁴、R⁴a、R⁴b、R⁵、R⁵a、R⁵b、R°におけるアシルとは、置換基を有していてもよいアルカノイルあるいはアロイルを意味し、アルカノイルとは炭素数1~20個の直鎖または分枝鎖状のアルカノイルであって、例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、プチリル、イソプチリル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、オクタノイル、ノナノイル、デカノイル、ウンデカノイル、ドデカノイル、トリデカノイル、テトラデカノイル、ペンタデカノイル、ヘキサデカノイル、ヘプタデカノイル、オクタデカノイル、ノナデカノイル、イコサノイル等があげられ、また、これらは置換基としてフェニルを有していてもよく、例えばフェニルアセチル、フェニルプロピオニル等があげられる。また、アロイルとしてはベンゾイル等があげられる。

R²、R²a、R³、R³a、R⁴、R⁴a、R⁵、R⁵a、R⁶におけるアルコキシ

カルボニルとは、そのアルコキシ部が炭素数 1~20個の直鎖または分枝鎖状で、置換基を有していてもよいアルコキシであって、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソプトキシカルボニル、第3級プトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、イソペンチルオキシカルボニル、第3級ペンチルオキシカルボニル、インペンチルオキシカルボニル、第3級ペンチルオキシカルボニル、ヘプチルオキシカルボニル、オクチルオキシカルボニル、ノニルオキシカルボニル、デシルオキシカルボニル、ウンデシルオキシカルボニル、ドデシルオキシカルボニル、トリデシルオキシカルボニル、テトラデシルオキシカルボニル、ペンタデシルオキシカルボニル、ヘキサデシルオキシカルボニル、ヘプタデシルオキシカルボニル、オクタデシルオキシカルボニル、ノナデシルオキシカルボニル、イコシルオキシカルボニル等があげられ、また、これらは置換基としてフェニルを有していてもよく、例えばベンジルオキシカルボニル等があげられる。

R⁴、R⁵ が結合するアルキレン鎖とは、炭素数が1~5個の直鎖または分枝 鎖状のアルキレンであって、例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、プロ ピレン、ブチレン、1,2-ジメチルエチレン、ペンタメチレン等があげられる。

R⁴、R⁵の置換基としてのアルキルとは、炭素数 1~5個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソプチル、第2級プチル、第3級プチル、ペンチル等があげられる。

R⁴、R⁵ の置換基としてのアリールとは、フェニル、ナフチル等があげられる。

 R^4 、 R^5 の置換基としてのアラルキルとは、アルキル部が炭素数 $1 \sim 5$ 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであるアラルキルであって、例えば、ベンジル、 2 - 7 ェネチル、1 - 7 ェニルエチル、1 - 7 ェニルプロピル、2 - 7 ェニルプロピル、3 - 7 ェニルプロピル、4 - 7 ェニルブチル、5 - 7 ェニルペンチル等があげられる。

 R^4 、 R^5 がアルキル、アリールまたはアラルキルにより置換されたアルキレン鎖とは、好ましくはエチリデン、イソプロピリデン、ベンジリデン、2-フェ

ニルエチリデン等があげられる。 本発明の好ましい化合物を以下の表に示す。

 $CH_{2}OR^{4}$ $R^{2}R^{3}N-C-CH_{2}OR^{5}$ $CH_{2}R^{1}$

R'	R²	R³	R ⁴	R⁵
CH(CH ₃)₂	Н	н	н	Н
CH(CH₃)C₂H₅	Н	Н	Н	н
CH(CH ₃)C ₃ H ₇	н	н	Н	Н
C(CH ₃) ₃	н	н	Н	Н
C(CH ₃) ₂ C ₂ H ₅	Н	Н	н	Н
C(CH ₃)₂C ₃ H ₇	Н	н	н	Н
C₅H₁₁	Н	Н	Н	н
C₅H,,	COCH3	Н	COCH3	COCH₃
C₅H₁₃	н	Н	н	н
C ₇ H ₁₅	н	Н	н	н
C ₇ H ₁₅	COCH₃	н	COCH3	COCH3
C₅H₁ ₇	Н	Н	H	H
C ₉ H ₁₉	н	Н	Н	н
C₃H₁9	COCH ₃	н	COCH₃	COCH₃
C ₁₀ H ₂₁	н	н	Н	Н
C₁₁H₂₂	н	Н	Н	Н
C ₁₁ H ₂₂	COCH ₃	н	COCH3	COCH3
[CH2CH(CH3)(CH2)2]2CH2CH(CH3)2	н	н	н	Н
[CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂] ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	COCH3	Н	COCH3	COCH₃
C _v H _≈	н	Н	н	н
C _v H _a	COCH₃	Н	COCH3	COCH3
C _{tt} H ₂₇	н	Н	Н	н
C ₁₃ H ₂₇	CH3	CH ₃	Н	н .
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₁₀ H ₂₁	н	н	н	н
C ₁₄ H ₂₉	н	н	Н	н
C _{is} H ₂₉	COCH3	н	COCH3	COCH3
C ₁₅ H ₃₁	Н	н	н	Н
C ₁₆ H ₃₃	Н	н	н	Н
C ₁₇ H ₃₅	н	Н	Н	Н
C₁₁H₃	C₂H₅	Н	н	Н

53

WO 94/08943

PCT/JP93/01515

R ¹	R²	R³	R⁴	R⁵
C ₁₇ H ₃₅	н	н	COCH ₃	COCH ₃
C ₁₇ H ₃₅	COC4H,	н	COCH₃	COCH3
C ₁₇ H ₃₅	COC ₄ H ₉	Н	н	Н
C₁₁H∞	C ₅ H ₁₁	н	н	н
C₁₁H₃₅	_e H _e OOO	Н	COCH₃	COCH ₃
C ₁₇ H ₃₅	COC ₉ H ₁₉	н	н	Н
C ₁₇ H ₃₅	C ₁₀ H ₂₁	н	н	Н
C₁₁H₃	CH₃	CH₃	COCH₃	COCH ₃
C ₁₇ H ₃₅	CH₃	CH₃	Н	н
C ₁₈ H ₃₇	Н	н	н	н
C₁9H₃	н	Н	Н	Н
C ₂₀ H ₄₁	Н	Н	н	Н
C ₂₁ H ₄₃	Н	н	Н	н
C ₂₂ H ₄₆	Н	Н	н	н
$C_{23}H_{er}$	Н	Н	Н	Н
C ₂₄ H ₄₉	н	н	Н	н
C _∞ H ₅₁	н	Н	н	Н
C₂ ₆ H₅₃	н	н	Н	Н
C ₂₇ H ₅₅	Н	Н	Н	Н
C ₂₈ H ₅₇	н	Н	Н	Н
C ₂₉ H ₂₉	н	н	Н	Н
CH=CH₂	н	н	Н	н
CH=CHCH₃	н	Н	Н	н
CH=CHC₂H₅	н	н	Н	н
CH=CHC₃H₁	Н	Н	Н	н
CH=CHC₄H ₉	н	Н	Н	н
CH=CHC ₅ H ₁₁	н	Н	Н	н
CH=CHC ₆ H ₁₃	н	Н	Н	н
CH=CHC ₇ H ₁₅	н	Н	Н	Н
CH=CHC ₉ H ₁₉	Н	Н	Ħ	н
CH=CHC ₁₁ H ₂₃	Н	Н	Н	н
CH=CHC ₁₃ H ₂₇	н	Н	н	н
CH=CHC ₁₅ H ₃₁	Н	Н	н	Н
CH=CHC ₁₇ H ₃₅	Н	Н	Н	Н

R'	R²	R³	R⁴	R⁵
CH=CHC ₂₇ H ₅₅	Н	Н	н	н
CH2CH=CH2	Н	н	' н	н
CH₂CH=CHCH₃	Н	н	н	н
CH₂CH=CHC₂H₅	н	н	н	Н
CH₂CH=CHC₃H₁	Н	н	н	Н
CH₂CH=CHC₄H ₉	Н	н	Н	н
CH₂CH=CHC₅H₁₁	н	н	Н	н
CH₂CH=CHC₅H₁₃	н	н	н	Н
CH₂CH=CHC ₈ H ₁₇	н	н	Н	Н
CH ₂ CH=CHC ₁₀ H ₂₁	Н	н	н	Н
CH₂CH=CHCvH₂	Н	н	н	Н
CH₂CH=CHC₁₄H₂	Н	н	н	Н
CH₂CH=CHC₁6H₂3	· H	н	н	Н
CH₂CH=CHCæH₅	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₂ H ₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₃ H ₇	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHC ₄ H ₉	Н	н	н	. Н
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₄ H ₉	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₅ H ₁₁	, н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₇ H ₁₅	н	Н.	Н	Н
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₉ H ₁₉	н	Н	н	Н
trans: (CH ₂) ₂ CH=CHC ₉ H ₁₉	Н	н	н	Н
cis: (CH ₂) ₂ CH=CHC ₉ H ₁₉	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₁₁ H ₂₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₁₃ H ₂₇	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₁₅ H ₃₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₂₅ H ₅₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ CH=CH ₂	Н	H	Н	Н
(CH ₂) ₃ CH=CHCH ₃	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3CH=CHC_2H_5$	Н	Н	Н	Н
(CH2)3C(CH3)=CHC3H7	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₃ H ₇	Н	H .	н	Н

R¹	R²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₃ CH=CHC₄H₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₆ H ₁₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₈ H ₁₇	н	н	н	н
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₁₀ H ₂₁	н	н	н	н
(CH2)3CH=CHCvHz	н	н	. н	н
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₁₄ H ₂₉	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₂₄ H ₄₉	н	н	H	. н
(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₄ CH=CHCH ₃	н	н,	Н	Н
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₂ H ₅	н	н	н	H
(CH ₂)₄CH=CHC ₃ H ₇	н	н	н	H
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₅ H ₁₁	н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₇ H ₁₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₉ H ₁₉	н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₁₁ H ₂₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₁₃ H ₂₇	н	н	Н	н
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₂₃ H ₄₇	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₅ CH=CH ₂	н	Н	н	Н
(CH ₂)₅CH=CHCH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂)₅CH=CHC ₂ H ₅	н	Н	н	Н
(CH ₂)₅CH=CHC₄H ₉	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ CH=CHC ₆ H ₁₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₅ CH=CHC ₈ H ₁₇	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₅ CH=CHC ₁₀ H ₂₁	н	Н	Н	Н
(CH₂)₅CH=CHCセHs	н	Н	Н	Н
(CH₂)₅CH=CHC ₂₂ H ₄₅	н	Н	Н	н .
(CH ₂) ₆ CH=CH ₂	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₆ CH=CHCH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₆ CH=CHC ₃ H ₇	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₆ CH=CHC ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₆ CH=CHC ₇ H ₁₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ CH(C ₂ H ₅)(CH ₂) ₃ CH=CHC ₉ H ₁₉	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₆ CH=CHC ₉ H ₁₉	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₆ CH=CHC ₁₁ H ₂₃	Н	н	Н	н

R¹	R²	R³	R¹	R ⁵
(CH ₂) ₆ CH=CHC ₂₁ H ₄₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ CH=CH ₂	н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ CH=CHC ₂ H ₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ CH=CHC₄H ₉	н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ CH=CHC ₆ H ₁₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₇ CH=CHC ₈ H ₁₇	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₇ CH=CHC ₁₀ H ₂₁	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₇ CH=CHC ₂₀ H ₄₁	н	н	н	Н
(CH ₂) ₈ CH=CHCH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₈ CH=CHC ₃ H ₇	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₈ CH=CHC ₅ H ₁₁	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₈ CH=CHC ₇ H ₁₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ CH=CHC ₉ H ₁₉	н	н	н	Н
(CH ₂) ₈ CH=CHC ₁₉ H ₃₉	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ CH=CHCH ₃	н	н	Н.	Н
(CH ₂) ₁₀ CH=CHC ₃ H ₇	н	Н	н	н
$(CH_2)_3CH(C_3H_7)(CH_2)_6CH=CHC_5H_{11}$	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ CH=CHC ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ CH=CHC ₇ H ₁₅	н	н	Н	Н
$(CH_2)_{10}CH=CHC_{17}H_{36}$	Н	Н	Н	Н
(CH₂) ₂ CH=CHCH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₃ H ₇	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂₂ CH=CHC ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₂ CH=CHC ₁₅ H ₃₁	Н	Н	Н	Н
(CH₂)14CH=CHCH3	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{14}C(CH_3)=CHC_3H_7$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ CH=CHC ₃ H ₇	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ CH=CHC ₁₃ H ₂₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₆ CH=CHCH ₃	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₁₆ CH=CHC ₁₁ H ₂₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ CH=CHC ₈ H ₁₇	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₀ CH≃CHC ₇ H ₁₅	H	Н	Н	Н
(CH ₂) _{Z2} CH=CHC ₅ H ₁₁	H	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₄ CH=CHC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н_

R¹	R²	R³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂₆ CH=CHCH ₃	Н	Н	Н	н
[CH=C(CH ₂)CH ₂ CH ₂] ₃ +H	Н	н	Н	н
[CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₂] ₃ +H	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
C=CH	н	Н	н	н
C≡CCH₃	н	Н	н	н
$C \equiv CC_2H_5$	Н	Н	н	н
$C \equiv CC_3H_7$	Н	н	Н	Н
C≡CC₄H ₉	н	н	н	Н
$C = CC_5H_{11}$	Н	н	н	н
C≡CC ₆ H ₁₃	Н	Н	н	Н
$C \equiv CC_7H_{15}$	Н	Н	н	Н
$C \equiv CC^{\theta}H^{i\theta}$	Н	Н	н	н
C≡CC ₁₁ H ₂₃	Н	Н	Н	н
C≡CC ₂ H ₂₅	н	Н	Н	н
C≡CC _v H _z	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
$C = CC_{13}H_{27}$	н	н	Н	н
$C = CC^{12}H^{31}$	Н	Н	Н	н
$C \equiv CC_{17}H_{35}$	Н	Н	н	н
C≡CC ₂₇ H ₅₅	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C≡CH	Н	Н	Н	н
CH ₂ C≡CCH ₃	Н	Н	Н	н
$CH_2C \equiv CC_2H_5$	Н	Н	Н	Н
$CH_2C \equiv CC_3H_7$	Н	Н	Н	Н
$CH_2C = CC_4H_9$	н	н	Н	Н
$CH_2C \equiv CC_5H_{11}$	Н	н	Н	Н
$CH_2C \equiv CC_6H_{13}$	Н	н	Н	Н
$CH_2C \equiv CC_8H_{17}$	н	н	Н	Н
$CH_2C \equiv CC_{10}H_{21}$	н	Н	Н	Н
CH ₂ C≡CC ₂ H ₂₅	н	Н	Н	Н
CH ₂ C≡CC ₁₄ H ₂₉	н	H	Н	Н
$CH_2C = CC^{16}H^{23}$	н	Н	н	Н
$CH^5C \equiv CC^{26}H^{23}$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C≡CH	, н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C≡CCH ₃	Н	H .	Н	Н

58

PCT/JP93/01515 WO 94/08943

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵
$(CH2)2C \equiv CC2H5$	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_2C \equiv CC_3H_7$	Н	Н	Н	Н
$(CH2)2C \equiv CC4H9$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2C \equiv CC_5H_{11}$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2C \equiv CC_7H_{15}$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2C \equiv CC_9H_{19}$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2C \equiv CC_{11}H_{23}$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2C \equiv CC_{13}H_{27}$	н	Н	Ĥ	Н
$(CH_2)_2C \equiv CC_{15}H_{31}$	Н	н	Н	Н
(CH2)2C = CC25H51	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C≡CH	Н	н	н	Н
$(CH_2)_3C = CCH_3$	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_3C \equiv CC_2H_5$	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_3C \equiv CC_3H_7$	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_3C \equiv CC_4H_9$	Н	Н	Н	Н
$(CH2)3C \equiv CC6H13$	Н	Н	Н	Н
(CH2)3C = CC8H17	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_2CH(CH_3)C \equiv CC_{10}H_{21}$	н	н	Н	Н
$(CH_2)_3C \equiv CC_{10}H_{21}$	н	н	Н	Н
$(CH2)3C \equiv CC12H25$	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ C≡CC ₁₄ H ₂₉	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_3C = CC_{24}H_{49}$	Н	н	Н	Н
(CH ₂)₄C≡CH	Н	н	н	Н
(CH ₂)₄C≡CCH ₃	Н	н	Н	Н
(CH2)4C = CC2H5	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_4C \equiv CC_3H_7$	Н	Н	Н	Н
$(CH2)4C \equiv CC5H11$	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_4C \equiv CC_7H_{15}$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_4C \equiv CC_9H_{19}$	Н	Н	Н	Н
(CH2)4C = CC11H23	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_4C \equiv CC_{13}H_{27}$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_4C \equiv CC_{23}H_{47}$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C≡CH	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C≡CCH ₃	H 59	Н	Н	Н

WO 94/08943

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵
$(CH_2)_5C \equiv CC_2H_5$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_5C \equiv CC_4H_9$	Н	н	н	Н
(CH2)5C = CC6H13	н	Н	н	Н
$(CH_2)_5C \equiv CC_8H_{17}$	н	н	н	н
$(CH_2)_5C \equiv CC_{10}H_{21}$	н	н	н	н
(CH ₂) ₅ C≡CC ₁₂ H ₂₅	н	н	н	н
$(CH_2)_5C \equiv CC_{22}H_{46}$	н	н	н	H
(CH ₂) ₆ C≡CH	н	н	н	н
$(CH_2)_6C \equiv CCH_3$	н	н	н	Н
$(CH_2)_6C \equiv CC_3H_7$	н	Н	Н	н
$(CH_2)_6C \equiv CC_5H_{11}$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_6C \equiv CC_7H_{15}$	Н	н	Н	н
$(CH_2)_6C \equiv CC_9H_{19}$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_6C \equiv CC_{11}H_{22}$	Н	н	. н	Н
$(CH_2)_6C \equiv CC_{21}H_{43}$	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ C≡CH	Н	н	н	Н
$(CH_2)_7C \equiv CC_2H_5$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_7C \equiv CC_4H_9$	Н	Н	н	Н
(CH2)7C = CC6H13	Н	н	н	Н
$(CH_2)_2CH(CH_3)(CH_2)_4C \equiv CC_8H_{17}$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_7C \equiv CC_8H_{17}$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_7 C \equiv CC_{10}H_{21}$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_7C \equiv CC_{20}H_{41}$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_8C \equiv CCH_3$	н	н	Н	Н
$(CH_2)_8C \equiv CC_3H_7$	н	Н	Н	Н
(CH2)8C = CC5H11	Н	Н	н	Н
(CH2)8C = CC7H15	• н	н	Н	Н
$(CH_2)_8C \equiv CC_9H_{19}$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_8C \equiv CC_{19}H_{29}$	н :	Н	Н	Н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH_3$	н	н	Н	Н
$(CH_2)_{10}C = CC_3H_7$	Н	Н	Н	Н
$(CH2)10C \equiv CC5H11$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_3CH(CH_3)(CH_2)_6C \equiv CC_7H_{15}$	н	н	Н	Н
$(CH2)10C \equiv CC7H15$	н	Н	Н	Н

60

PCT/JP93/01515

R¹	R²	R ³	R ⁴	R⁵
(CH ₂) ₁₀ C≡CC ₁₇ H ₃₅	н	Н	н	Н
$(CH2)12C \equiv CCH3$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{22}C \equiv CC_3H_7$	н	н	Н	Н
$(CH_2)_{12}C \equiv CC_5H_{11}$	н	н	н	Н
$(CH_2)_{12}C \equiv CC_{15}H_{31}$	Н	. н	н	Н
$(CH_2)_{14}C \equiv CCH_3$	Н	н	Н	Н
$(CH2)14C \equiv CC3H7$	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₄ C≡CC ₁₃ H ₂₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₆ C≡CCH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₆ C≡CC ₁₁ H ₂₃	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_{18}C \equiv CC_9H_{19}$	н	Н	Н	Н
$(CH2)20C \equiv CC7H15$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{22}C \equiv CC_5H_{11}$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{24}C \equiv CC_3H_7$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{\infty}C \equiv CCH_3$	н	Н	Н	Н
CH₂OH	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ OH	н	Н	Н	Н
CH₂(OH)CH₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ OH	н	Н	н	Н
(CH₂)₄OH	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ OH	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₆ OH	Н	Н	Н	Н
(CH₂) ₇ OH	Н	Н	Н	Н
(CH₂) ₈ OH	н	н	Н	Н
(CH₂) ₉ OH	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ OH	Н	Н	Н	Н
(CH₂),1OH	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₆ CH(C ₆ H ₁₃)OH	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₆ CH(C ₆ H ₁₃)OH	COCH₃	Н	COCH3	COCH ₃
(CH ₂) ₁₇ OH	н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₉ OH	н	Н	н	Н
(CH₂) _æ OH	н	Н	н	Н
СООН	н	Н	н	Н
CH₂COOH	н	Н	н	Н

WO 94/08943

PCT/JP93/01515

R¹ .	R²	R ³	R⁴	R ⁵
(CH₂)₂COOH	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₃COOH	Н	н	н	н
(CH₂)₄COOH	н	н	н	Н
(CH ₂) ₅ COOH	н	Н	н	н
(CH₂)₅COOH	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₇ COOH	н	н	н	н
(CH₂) ₈ COOH	н	н	н	н
(CH ₂) ₉ COOH	н	н	н	н
(CH ₂) ₁₀ COOH	н	н	н	н
(CH ₂) ₁₁ COOH	н	н	н	н
(CH₂)₁7COOH	н	н	н .	Н
(CH₂) ₁₉ COOH	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂₂ COOH	н	н	н	Н
CH₂COOCH₃	н	н	н	н
CH₂COOC₂H₅	н	н	н	Н
CH ₂ COOC ₁₀ H ₂₁	Н	н	н	Н
CH ₂ COOC ₁₄ H ₂₉	н	Н	н	Н
(CH₂)₂COOCH₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ COOC ₂ H ₅	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ COOC ₁₀ H ₂₁	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ COOC ₁₃ H ₂₇	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ COOCH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂)₃COOC₂H₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ COOC ₁₀ H ₂₁	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ COOC ₂₂ H ₂₅	н	н	Н	Н
(CH ₂)₄COOCH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂)₄COOC₂H ₅	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ COOC ₁₀ H ₂₁	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ COOC ₁₁ H ₂₃	н	Н	Н	Н
(CH₂)₅COOCH₃	н	Н	Н	н
(CH₂)₅COOC₂H₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₅ COOC ₁₀ H ₂₁	н	н	н	Н
(CH ₂) ₆ COOCH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₅ COOC ₂ H ₅	Н	н	н	Н

R'	R²	R³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₆ COOC ₉ H ₁₉	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ COOCH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ COOC ₂ H ₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₇ COOC ₈ H ₁₇	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₈ COOCH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₃ CH(C₄H₃)COOC ₂ H₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₈ COOC ₇ H ₁₅	н	Н	н -	Н
(CH ₂) ₉ COOCH ₃	н	н	Н	Н
$(CH_2)_9COOC_2H_5$	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₉ COOC ₆ H ₁₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ COOCH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ COOCH ₃	COCH ₃	н	COCH3	COCH₃
(CH ₂) ₁₀ COOC ₂ H ₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₀ COOC ₅ H ₁₁	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ COOCH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂),1COOC ₂ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ COOC ₄ H ₉	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₇ COOCH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₇ COOC ₂ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ COOC ₁₀ H ₂₁	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₉ COOCH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ COOC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ COOC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₉ COOCH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂₉ COOC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₉ COOC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
CH₂OCOCH₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ OCOC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
CH ₂ OCOC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
CH ₂ OCOC ₁₄ H ₂₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ OCOCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ OCOC ₂ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ OCOC ₃ H ₇	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ OCOC ₁₃ H ₂₇	Н	Н	Н	Н_

WO 94/08943

PCT/JP93/01515

R'	R²	R³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₃ OCOCH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ OCOC ₂ H ₅	н	Н	Ĥ	н
(CH ₂) ₃ OCOC ₃ H ₇	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ OCOC ₁₂ H ₂₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₄ OCOCH ₃	Н	Н	н	н
(CH ₂)₄OCOC₂H ₅	н	н	н	н
	н	Н	н	н
(CH ₂) ₄ OCOC ₁₁ H ₂₃	н	Н	н	н
(CH ₂)₅OCOCH ₃	, н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ OCOC ₂ H ₅	н	Н	н	н
(OH ₂) ₅ OCOC ₃ H ₇	н	н	н	н
(CH ₂) ₅ OCOC ₁₀ H ₂₁	н	Н	н	н
(CH ₂) ₆ OCOCH ₃	н	Н	н	н.
(CH ₂) ₆ OCOC ₂ H ₅	н	Н	н	н
	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₆ OCOC ₉ H ₁₉	н	Н	Н	Η,
(CH ₂) ₇ OCOCH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ OCOC ₂ H ₅	• н	Н	н	Н
(CH ₂) ₇ OCOC ₃ H ₇	н	Н	н	н
(CH ₂) ₇ OCOC ₆ H ₁₇	н	н .	Н	Н
(CH ₂) ₈ OCOCH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ OCOC ₂ H ₅	н	Н	Н	Н
	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₈ OCOC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₉ OCOCH ₃	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_9OCOC_2H_5$	н	Н	Н	н
(CH2)2CH(C6H13)OCOC3H7	н	Н	н	H ·
(CH ₂) ₉ OCOC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ OCOCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ OCOC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ OCOC ₃ H ₇	н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₀ OCOC ₅ H ₁₁	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ OCOCH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ OCOC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н

PCT/JP93/01515

R¹	R ²	R ³	R ⁴	R⁵
(CH ₂) ₁₁ OCOC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ OCOC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ OCOCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ OCOC ₂ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ OCOC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ OCOC ₉ H ₉	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ OCOCH ₃	Н	Н	H ,	Н
(CH ₂) ₁₉ OCOC ₂ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ OCOC ₃ H ₇	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ OCOC ₉ H ₁₉	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₉ OCOCH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂₉ OCOC ₂ H ₅	, . Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₉ OCOC ₃ H ₇	. н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₉ OCOC ₉ H ₁₉	н	Н	Н	Н
CH(CH3)OCOCH3	н	Н	н	Н
CH(CH ₃)OCOC ₂ H ₅	н	н	н	Н
CH(CH ₃)OCOC ₃ H ₇	н	Н	Н	Н
CH(CH ₃)OCOC ₁₄ H ₂₉	Н	н	Н	Н
CH ₂ COC ₇ H ₁₅	н	н	Н	H
CH ₂ COC ₉ H ₁₉	н	н	Н	Н
CH ₂ COC ₁₁ H ₂₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₆ COC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₆ COC ₆ H ₁₃	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH3
CH ₂ COC ₁₅ H ₃₁	Н	Н	Н	Н
CH₂COC₁₁H₃	н	Н	Н	Н
(CH₂)₂SC₂H₂s	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₂SC₂H₂s	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH ₃
CH ₂ CH(C ₇ H ₁₅)SCH ₃	Н	Н	Н	Н
CH₂CH(C7H15)SC2H5	Н	Н	Н	Н
CH ₂ CH(C ₇ H ₁₅)SC ₇ H ₁₅	н	Н.	Н	Н
(CH ₂) ₉ SCH ₃	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_9SC_2H_5$	H	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ SC ₇ H ₁₅	н	Н	Н	Н
CH ₂ CH(C ₉ H ₁₉)SCH ₃	H	H	Н	H

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵
CH ₂ CH(C ₉ H ₁₉)SC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
CH₂CH(C₂H₁9)SC₁H₁5	н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ SCH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂),1SC ₂ H ₅	н	н	н	н
(CH ₂),,SC ₇ H ₁₅	н	н	н	Н
CH2CH(C11H2)SCH3	н	н	Н	Н
CH₂CH(C₁₁H₂)SC₂H₅	Н	н	Н	н
CH ₂ CH(C ₁₁ H ₂₂)SC ₃ H ₇	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ SCH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₃ SC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ SC ₇ H ₁₅	н	Н	Н	Н
CH₂CH(C₁₅H₃₁)SCH₃	н	н	Н	Н
CH₂CH(C₁₅H₃₁)SC₂H₅	Н	н	н	Н
CH ₂ CH(C ₁₅ H ₃₁)SC ₁₀ H ₂₁	Н	н	Н	Н
CH₂CH(C₁7H₃)SCH₃	Н	Н	н	Н
CH ₂ CH(C ₁₇ H ₃₅)SC ₂ H ₅	н	Н	н	Н
CH₂CH(C₁7H₃5)SC₁0H₂1	н	Н	Н	Н
CH₂NH₂	н	н	Н	Н.
(CH ₂) ₂ NH ₂	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ NH ₂	Н	н	н	Н
(CH₂)₄NH₂	н	н	н	Н
(CH ₂) ₅ NH ₂	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₆ NH ₂	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ CH(C ₃ H ₇)NH ₂	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₈ NH ₂	Н	н	н	н
(CH ₂) ₉ NH ₂	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₀ NH ₂	Н	н	н	н
(CH ₂) ₁₁ NH ₂	н	Н	Н	Н
(CH ₂)₁7NH₂	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ NH ₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₈ NH ₂	Н	Н	Н	Н
CH₂NHCOOCH₃	Н	Н	Н	Н
CH2NHCOOC2H5	н	Н	Н	Н
CH2NHCOOC10H21	H	Н	Н	Н

R¹ /	R²	R ³	R⁴	R ⁵
CH₂NHCOOC₁₄H₂	Н	н	н	Н
(CH₂)₂NHCOOCH₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ NHCOOC ₂ H ₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ NHCOOC ₁₃ H ₂₇	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ NHCOOCH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ NHCOOC ₂ H ₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ NHCOOC 10H ₂₁	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ NHCOOC ₁₂ H ₂₅	н	н	Н	Н
(CH ₂)₄NHCOOCH ₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₄ NHCOOC ₂ H ₅	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	н	Н
(CH₂)₄NHCOOC11H₂3	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₅NHCOOCH₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₅ NHCOOC ₂ H ₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₅ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
(CH₂) ₆ NHCOOCH₃	Н	н	Н	Н
(CH₂) ₆ NHCOOC₂H₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₆ NHCOOC ₉ H ₁₉	Н	Н	Н	Н
(CH₂),NHCOOCH₃	Н	н	Н	Н
(CH₂)₁NHCOOC₂H₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ NHCOOC ₈ H ₁₇	Н	н	Н	Н
(CH₂)₅NHCOOCH₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ NHCOOC ₂ H ₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₈ NHCOOC ₇ H ₁₅	н	Н	Н	Н
(CH₂) ₃ NHCOOCH₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ NHCOOC ₂ H ₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₉ NHCOOC ₆ H ₁₃	н	Н	Н	Н
(CH₂)10NHCOOCH3	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ NHCOOC ₂ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₀ NHCOOC ₅ H ₁₁	н	Н	н	Н
(CH₂)11NHCOOCH3	н	н	Н	. Н
(CH ₂) ₁₁ NHCOOC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ NHCOOC ₄ H ₉	Н	Н	Н	н

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH₂) ₁₇ NHCOOCH₃	- н	Н	Н	н
(CH ₂) ₁₇ NHCOOC ₂ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₇ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	Н	н	н	н
(CH ₂) ₈ CH(C ₁₀ H ₂₁)NHCOOCH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₁₉ NHCOOC ₂ H ₅	н	н	н	н
(CH ₂) ₁₉ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	н	н	H	н
(CH₂) ₂₂ NHCOOCH₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂₉ NHCOOC ₂ H ₅	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂₉ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	Н	н	н	н
CH₂NHCOCH₃	Н	н	н	н
CH₂NHCOC₂H₅	н	н	н	н
CH₂NHCOC₃H₁	н	Н	н	н
CH₂NHCOC₁₁H₂₃	Н	Н	н	н
CH₂NHCOC₁₄H₂	н	Н	Н	, H
(CH₂)₂NHCOCH₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ NHCOC ₂ H ₅	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ NHCOC ₃ H ₇	н	н	Н	Н
(CH ₂)₂NHCOC ₁₃ H ₂₇	н	Н	·H	н
(CH₂)₃NHCOCH₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ NHCOC ₂ H ₅	н	н	Н	Н
(CH₂)₃NHCOC₃H₁	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ NHCOC ₁₂ H ₂₅	н	н	н	Н
(CH₂)₄NHCOCH₃	Н	н	н	н
(CH ₂),NHCOC ₂ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ NHCOC ₃ H ₇	` н	н	н	н
(CH ₂)₄NHCOC ₁₁ H ₂₃	н	Н	Н	Н
(CH₂)₅NHCOCH₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂)₅NHCOC ₂ H ₅	н	н	Н	Н
(CH₂)₅NHCOC₃H₁	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₅ NHCOC ₁₀ H ₂₁	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₆ NHCOCH ₃	Н	Н	Н	H.
(CH ₂) ₆ NHCOC ₂ H ₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₆ NHCOC ₃ H ₇	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₆ NHCOC ₉ H ₁₉	H	Н	Н	Н

R¹	R ²	R ³	R⁴	R ⁵
(CH ₂),NHCOCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ NHCOC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ NHCOC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ NHCOC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ NHCOCH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₈ NHCOC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ NHCOC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ NHCOC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ NHCOCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ NHCOC ₂ H ₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₄ CH(C ₄ H ₉)NHCOC ₃ H ₇	Н	Н	н⊸	Н
(CH ₂) ₉ NHCOC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	Н
(CH₂)10NHCOCH3	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ NHCOC₂H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ NHCOC ₃ H ₇	, Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₀ NHCOC ₂ H ₁₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ NHCOCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ NHCOC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ NHCOC ₃ H ₇	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₁₁ NHCOC ₄ H ₉	Н	н	н	Н
(CH₂)₁7NHCOCH₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ NHCOC ₂ H ₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ NHCOC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ NHCOC ₉ H ₁₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ NHCOCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ NHCOC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ NHCOC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ NHCOC ₉ H ₁₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₂ NHCOCH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂₉ NHCOC ₂ H ₅	Н	. Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₉ NHCOC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₈ NHCOC ₉ H ₁₉	H	Н	н	Н
CH(CH₃)NHCOCH₃	Н	Н	Н	Н
CH(CH₃)NHCOC₂H₅	Н	Н	Н	Н

R¹	R ²	R³	R⁴	R⁵
CH(CH ₃)NHCOC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
CH(CH₃)NHCOC₁₄H₂₃	н	н	н	н
CH₂NHCH₃	н	н	н	н
CH₂NHC₂H₅	н	н	н	Н
CH₂NHC₃H₁	н	Н	н	Н
CH₂NHC₂H₂s	Н	н	н	Н
CH ₂ NHC ₁₅ H ₃₁	Н	н	н	H
(CH ₂) ₂ NHCH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ NHC ₂ H ₅	н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ NHC ₃ H ₇	Н	Н	н	H
(CH ₂) ₂ NHC ₁₄ H ₂₉	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ NHCH ₃	Н	н	н	Н
(CH₂)₃NHC₂H₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ NHC ₃ H ₇	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ NHC ₁₃ H ₂₇	н	н	н	Н
(CH₂)₄NHCH₃	н	н	н	Н
(CH ₂)₄NHC ₂ H ₅	н	н	н	Н
(CH₂)₄NHC₃H₁	Н	н	н	Н
(CH ₂)₄NHC ₁₂ H ₂₅	. н	н	н	Н
(CH ₂) ₅ NHCH ₃	н	н	н	Н
(CH₂)₅NHC₂H₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₅ NHC ₃ H ₇	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ NHC ₁₁ H ₂₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₆ NHCH ₃	н	Н	Н	Н
(CH₂) ₆ NHC₂H₅	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₆ NHC ₃ H ₇	н	н	Н	н
(CH ₂) ₆ NHC ₁₀ H ₂₁	н	Н	Н	Н
(CH ₂),NHCH ₃	н	Н	Н	Н
(CH₂)₂NHC₂H₅	н	Н	Н	Н
(CH₂)₁NHC₃H₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ NHC ₉ H ₁₉	н	Н	Н	Н
(CH₂) ₈ NHCH₃	н	Н	н	Н
(CH₂) ₈ NHC₂H₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₈ NHC ₃ H ₇	н	Н	н	Н

R¹	R²	R³	R ⁴	R⁵
(CH ₂) ₈ NHC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ NHCH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₉ NHC ₂ H ₅	Н	н	H	Н
(CH ₂) ₉ NHC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ NHC ₇ H ₁₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ NHCH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ NHC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ NHC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ NHC ₆ H ₁₃	, н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ NHCH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ NHC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ NHC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ CH(C ₆ H ₁₃)NHC ₅ H ₁₁	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ NHCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ NHC ₂ H ₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₇ NHC ₃ H ₇	н	н	Н	Η.
(CH ₂) ₁₇ NHC ₁₀ H ₂₁	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ NHCH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ NHC ₂ H ₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₉ NHC ₃ H ₇	н	Н	. Н	Н
(CH ₂) ₁₉ NHC ₁₀ H ₂₁	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂₉ NHCH ₃	Н.,	н	Н	Н
(CH ₂) ₂₉ NHC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₉ NHC ₃ H ₇	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂₉ NHC ₁₀ H ₂₁	· н	Н	Н	Н
CONHCH ₃	Н	Н	Н	Н
CONHC₂H₅	н	Н	Н	Н
CONHC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
COOC ₁₅ H ₃₁	Н	Н	Н	Н
CH₂CONHCH₃	Н	Н	Н	Н
CH₂CONHC₂H₅	Н	Н	Н	Н
CH₂CONHC₁0H₂1	Н	Н	Н	Н
CH₂CONHC₁₄H₂	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₃CONHCH₃	Н	Н	Н	Н

·R'	R ²	R³	R⁴	R ⁵
(CH ₂) ₃ CONHC ₂ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₃ CONHC ₁₀ H ₂₁	Н	н	· H	н
(CH ₂) ₃ CONHC ₂₂ H ₂₅	н	Н	н	н
(CH₂)₄CONHCH₃	н	н	Н	н
(CH ₂) ₄ CONHC ₂ H ₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ CONHC 10H ₂₁	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ CONHC ₁₁ H ₂₃	Н	н	н	н
(CH₂)₅CONHCH₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₅ CONHC ₂ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ CONHC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	н	н
(CH₂) ₆ CONHCH₃	Н	Н	н	н
(CH2)6CONHC2H5	Н	н	н	н
(CH ₂) ₆ CONHC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₇ CONHCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ CONHC ₂ H ₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₇ CONHC ₈ H ₁₇	н	н	н	н
(CH ₂) ₈ CONHCH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₈ CONHC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ CONHC ₇ H ₁₅	н	Н	Н	Н
(CH₂) ₉ CONHCH₃	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₉ CONHC ₂ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ CONHC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ CONHCH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₀ CONHC ₂ H ₅	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₁₀ CONHC ₅ H ₁₁	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ CONHCH ₃	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₁ CONHC ₂ H ₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₁ CONHC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ CONHCH ₃	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_8CH(C_8H_{17})CONHC_2H_5$	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₁₇ CONHC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₁₉ CONHCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ CONHC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ CONHC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н

R¹	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH₂) ₂₂ CONHCH₃	Н	Н	Н	Н
(CH₂) ₂₂ CONHC₂H₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂₈ CONHC ₁₀ H ₂₁	н	Н	Н	Н
CH ₂ NO ₂	н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ NO ₂	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ NO ₂	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ NO ₂	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ NO ₂	н	н	н	Н
(CH ₂) ₆ NO ₂	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₇ NO ₂	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₈ NO ₂	н	Ħ	н	Н
(CH ₂) ₉ NO ₂	н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₀ NO ₂	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ CH(C ₆ H ₁₃)NO ₂	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ NO ₂	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₉ NO ₂	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂₈ NO ₂	Н	Н	Н	Н
CH₂CI	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ CI	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ CI	Н	Н	н	Н
(CH ₂)₄CI	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₅ CI	Н	Н	Н	Н
(CH₂) ₆ CI	Н	н	н	Н
(CH₂) ₇ CI	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ Cl	H	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ Cl	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ Cl	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ Cl	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ Cl	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ CI	Н	Н	Н	H
(CH ₂) ₂₆ CI	Н	Н	н	Н
CH₂Br	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₂Br	Н	Н	н	Н
(CH₂)₃Br	Н	Н	Н	Н

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH₂)₄Br	Н	Н	н	н
(CH₂)₅Br	Н	Н	H	н
(CH₂) ₆ Br	Н	н	Н	н
(CH₂) ₇ Br	н	Н	н	н
(CH ₂) ₈ Br	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ CHBrC ₆ H ₁₃	н	Н	Н	н
(CH₂)₀Br	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₁₁ Br	н	Н	н	Н
(CH₂)₁7Br	. н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₉ Br	н	Н	н	н
(CH₂) ₂₉ Br	н	Н	н	н
CH₂F	н	н	н	н
(CH₂)₂F	н	Н	н	н
(CH ₂) ₃ F	Н	н	н	Н
(CH₂)₄F	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₅ F	Н	Н	Н	н
(CH₂) ₆ F	н	Н	Н	н
(CH₂),F	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₈ F	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₉ F	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₀ F	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ F	н	Н	н	н
(CH₂) ₁₁ F	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ F	н	Н	н	Н
(CH₂) _₹ F	COCH₃	Н	COCH3	COCH ₃
(CH ₂) ₃ CHFC ₇ H ₁₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ F	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ F	COCH₃	Н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₂₂ CHF ₂	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ CHF ₂	COCH₃	Н	COCH₃	COCH3
(CH ₂) ₂ CF ₃	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ CF ₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₁₄ F	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₁₄ F	COCH ₃	Н	COCH3	COCH ³

R'	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH₂)₁₁F	Н	Н	н	Н
(CH₂) _® F	· н	Н	н	н
(CH₂) ₂₈ F	н	Н	Н	Н
CH₂OCH₃	н	н	Н	Н
CH ₂ OC ₂ H ₅	н	н	н	Н
CH ₂ OC ₁₅ H ₃₁	н	н	Н	Н
(CH₂)₂OCH₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ OC ₂ H ₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ OC ₁₅ H ₃₁	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ OCH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ OC ₁₃ H ₂₇	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ OCH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ OC ₂ H ₅	Н	н	н	Н
(CH₂)₄OC₂H₂s	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₅ OC ₈ H ₁₇	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₅ OC ₈ H ₁₇	COCH ₃	Н	COCH3	COCH3
(CH ₂) ₅ OC ₁₁ H ₂₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₆ OC ₇ H ₁₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₆ OC ₇ H ₁₅	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₆ OC ₁₀ H ₂₁	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ OC ₆ H ₁₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ OC ₆ H ₁₃	COCH₂	Н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₇ OC ₉ H ₁₉	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ OC ₅ H ₁₁	. Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ OC ₅ H ₁ ;	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₈ OC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ OC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ OC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ OC ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) _E OC ₄ H ₉	Н	Н	Н	. H·
(CH ₂) ₁₃ OC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ OC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Η.
(CH ₂) ₁₅ OCH ₃	Н	Н	Н	н

				
R ¹	R²	R ³	R ⁴	R⁵
CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ OCH ₂ CH=CH ₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ OCH ₂ CH=CH ₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ OCH ₂ CH=CH ₂	Н	н	Н	Н
CH2OCH2CH=CHCH3	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ OCH ₂ CH=CHCH ₃	Н	Ħ	н	Н
(CH ₂) ₃ OCH ₂ CH=CHCH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₉ OCH ₂ CH=CHCH ₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₂ OCH ₂ CH=CHCH ₃	Н	Н	Н	н
CH2OCH2CH=CHC7H15	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ OCH ₂ CH=CHC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₃ OCH ₂ CH=CHC ₇ H ₁₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₆ OCH ₂ CH=CHC ₇ H ₁₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₉ OCH ₂ CH=CHC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
CH ₂ OCH ₂ C≡CH	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2OCH_2C = CH$	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₃ OCH ₂ C=CH	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ OCH ₂ C≡CH	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{11}CH(CH_3)OCH_2C = CH$	Н	Н	Н	Н
CH₂OCH₂C≡CCH₃	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2OCH_2C \equiv CCH_3$	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_3OCH_2C = CCH_3$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_9OCH_2C = CCH_3$	н	Н	Н	н
$(CH_2)_{12}OCH_2C \equiv CCH_3$	Н	Н	Н	н
$CH_2OCH_2C \equiv CC_7H_{15}$	Н	H	н	н
(CH2)2OCH2C=CC7H15	Н	н	Н	н
$(CH_2)_3OCH_2C = CC_7H_{15}$	н	н	Н	Н
$(CH_2)_6OCH_2C = CC_7H_{15}$	Н	н	н	Н
(CH2)9OCH2C=CC7H15	Н	. Н	Н	Н
CH2OCH2C6H5	н	н	н	Н
	н	н	Н·	Н
CH ₂ O(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ OCH ₂ C ₆ H ₅	Н	н	Н	Н

76

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2O(CH_2)_3C_6H_5$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ OCH ₂ C ₆ H ₅	Н	H.	н	Н
$(CH_2)_3O(CH_2)_2C_6H_5$	н	Н	Н	н
$(CH_2)_3O(CH_2)_3C_6H_5$	н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ OCH ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ O(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	. Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	н	H.	Н	Н
(CH ₂) ₅ O(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_5O(CH_2)_3C_6H_5$	COCH₃	Н	COCH₃	COCH3
$(CH_2)_6O(CH_2)_2C_6H_5$	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₇ OCH ₂ C ₆ H ₅	н	Н	Н	Н
	COCH₃	Н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₇ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_8O(CH_2)_2C_6H_5$	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₁₀ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₂ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_8CH(C_4H_9)O(CH_2)_2C_6H_5$	н	H.	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₅ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
C ₁₇ H ₃₅	CH ₃	Н	Н	Н
· C ₁₇ H ₃₅	CH₃	CH ₃	Н	Н
C ₁₇ H ₃₅	C ₁₈ H ₃₇	Н	Н	Н
C ₁₇ H ₃₅	C ₁₈ H ₃₇	C ₁₈ H ₃₇	Н	Н
C ₁₇ H ₃₆	COCH3	Н	Н	' Н
C ₁₇ H ₃₅	COC ₁₇ H ₃₅	н	Н	Н
CH₂C ₆ H₅	Н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₅	COCH3	Н	COCH3	COCH3
CH(CH₃)C ₆ H₅	Н	Н	Н	Н
CH=CHC ₆ H ₅	Н	H	Н	Н
CH=CHC ₆ H ₅	COCH ₃	Н	COCH3	COCH ₃

R'	R²	R³	R⁴	R⁵
C=CC ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
$C = CC_6H_5$	COCH ₃	Н	COCH3	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
CH₂CH(CH₃)C ₆ H₅	н	Н	Н	н
CH₂CH(CH₃)C₅H₅	COCH₃	Н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂)₄C ₆ H ₅	Н	H	н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	COCH₃	Н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH₂) ₇ C ₆ H₅	Н	н	н	Н
(CH₂) ₈ C ₆ H ₅	н	н	Н	н
(CH₂) ₉ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	COCH₃	н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₁	н	Н	н	. н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₁₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH₂)₂C ₆ H₅	COCH3	Н	COCH ₃	COCH3
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₅ C ₆ H ₅	Н	H	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₉ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH₂) _æ C ₆ H₅	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -3-CH ₃	Н	н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-CH ₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -3-C ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	Н	Н	H	Н
C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	н	Н	Н	н
C ₆ H ₄ -2-C ₃ H ₇	н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-C ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
C_6H_4 -3- C_4H_9	Н	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -3-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	н
C ₆ H ₄ -4-C ₉ H ₁₉	Н	н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-C ₉ H ₁₉	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH₃

'R'	R²	R³	R ⁴	R ⁵
C ₆ H ₁₀ -3-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -3-C ₁₀ H ₂₁	н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-C ₁₀ H ₂₁	н	Н	. н	Н
C ₆ H ₄ -3-C ₁₂ H ₂₅	н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-C ₁₂ H ₂₅	н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -3-C ₂₀ H ₄₁	н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-C ₂₀ H ₄₁	Н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-3-CH₃	н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-4-CH₃	H [.]	Н	н	Н
CH₂C ₆ H₄-3-C₂H₅	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	н	Н	н	Н
CH₂C ₆ H₄-4-C₃H ₇	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₄ H ₉	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-3-C ₆ H ₁₃	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-C ₄ H ₉	н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-2-C ₆ H₁₃	н	н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-4-C ₆ H₁₃	н	н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ CH(CH ₃) ₂	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ CH(CH ₃) ₂	COCH3	Н	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	COCH3	Н	COCH₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	COCH₃	Н	н	Н
CH₂C ₆ H₄-4-C ₈ H₁ ₇	COCH₃	Н	COCH3	COCH
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	CH ₃	CH ₃	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-C ₈ H ₁₇	н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-2-C ₈ H₁ ₇	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH
CH₂C ₆ H₄-3-C ₈ H₁ ₇	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₈ H ₁₇	COCH3	Н	COCH ₃	COCH
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₁₀ H ₂₁	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₁₀ H ₂₁	Н	Н_	Н	Н

79

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵
CH₂C₅H₄-3-CvHz	Н	Н	Н	Н
CH₂C₀H₄-4-C₁₂H₂₅	Н	Н	н	н
CH₂C₀H₄-4-Cv2Hzs	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH3
$CH_2C_6H_4$ -3- C_∞ H ₄₁	Н	Н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₂₀ H ₄₁	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-CH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₂ H ₅	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₇ H ₁₂ -3-C ₂ H ₅	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	н	н	H	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₃ H ₇	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₄ H ₉	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₆ H ₁₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-C ₇ H ₁₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-C ₇ H ₁₅	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH3
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₁₀ H ₂₁	Н	Н	н	· H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₁₀ H ₂₁	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₁₁ H ₂₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH₃
$(CH_2)_2C_6H_4$ -3- $C_{12}H_{25}$	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₁₂ H ₂₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₂₀ H ₄₁	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₂₀ H ₄₁	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-CH ₃	H	Н	Н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₂ H ₅	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	. н	Н	н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	н	Н	н	н́
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₃ H ₇	Н	Н	н	Н

R ¹	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₄ H ₉	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-C ₄ H ₉	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-C ₄ H ₉	COCH ₃	Н	COCH3	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	COCH₃	н	COCH₃	COCH3
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₆ H ₁₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₇	. н	Н	• Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₇	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₁₀ H ₂₁	н	Н	н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₁₀ H ₂₁	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -2-C ₁₀ H ₂₁	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₁₂ H ₂₅	н	Н	н	н
(CH₂)₃C₀H₄-4-C₂H≈	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₂₀ H ₄₁	н	Н	Н	Н.
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₂₀ H ₄₁	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-CH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CH ₃	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_4C_6H_4-3-C_2H_5$	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	н	Н	H	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
CH2CH=CHCH2C6H4-3-C3H7	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₃ H ₇	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	· н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -2-C ₁₂ H ₂₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₁₂ H ₂₅	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_4C_6H_4$ -4- $C_{12}H_{25}$	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₄C₅Hஶ-4-CセH≈	H 81	Н	Н	<u> </u>

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₂₀ H ₄₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₂₀ H ₄₁	н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-CH ₃	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₂ H ₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₃ H ₇	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₄ H ₉	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	COCH₃	Н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -2-C ₆ H ₁₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₆ H ₁₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₁₀ H ₂₁	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₁₀ H ₂ ,	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₁₀ -4-C ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₁₂ H ₂₅	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₁₂ H ₂₅	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₂₀ H ₄₁	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₂₀ H ₄₁	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-C ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	H	Н	н	н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	н	н	Н	н
(CH ₂),C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
$(CH_2)_2CH=C(C_3H_7)C_6H_{10}-4-C_6H_{13}$	н	н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -3-C ₅ H ₁₁	Н	н	н	н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -3-CH ₃	Н	Н	Н	н
C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	Н	Н	Н	н

82

R¹ .	R²	R³	R ⁴	R⁵
C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	Н	Н	Н	Н
CH₂C6H43-CH=CH2	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	Н	н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-CH=CHCH ₃	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CHCH ₃	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-CH=CHCH ₃	н	н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-CH=CHC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
CH₂C₀H₄-4-CH=CHC₀H₁₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	н	Н	Н	Н
(CH2)2C6H4-3-CH=CHCH3	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CHCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-CH=CHCH ₃	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4$ -3-CH=CHC ₈ H ₁₇	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CHC ₈ H ₁₇	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-CH=CHCH ₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-CH=CHCH ₃	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3C_6H_4$ -3-CH=CHC ₈ H ₁₇	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-CH=CHC ₆ H ₁₇	Н	н	Н	Н
$CH_2CH(CH_3)C_6H_4-4-CH=CHC_8H_{17}$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_4C_6H_4$ -3- $CH=CHCH_3$	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CH≕CHCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -2-CH=CHC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-CH=CHC ₈ H ₁₇	н	Н	Н	Н
CH2CH(C2H5)-C5H8-3-CH=CHC8H17	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CH=CHC ₈ H ₁₇	Н	H	Н	Н
CH=CH(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CHC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-CH=CHCH ₃	H	Н '	Н	Н

R¹	R²	R³	R ⁴	R⁵
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-CH=CHCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-CH=CHC ₈ H ₁₇	н	н	н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	н	н	н	н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	н	н	Н	Н
(CH ₂),C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₃₀ -3-CH=CHCH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂),C ₆ H ₄ -3-CH ₂ CH=CH ₂	н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-CH=CHCH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂),C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	н	н	н	н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH=CHC ₂ H ₅	н	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -3-C≡CH	н	н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-C≡CH	Н	н	Н	н
C ₆ H ₁₀ -4-C≡CH	н	нĺ	н	н
$CH_2C_6H_4$ -3- C = CH	н	н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C≡CH	Н	н	н	Н
$CH_2C_6H_4-3-C = CCH_3$	Н	н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C≡CCH ₃	Н	н	н	н
$CH_2C_6H_4-3-(CH_2)_6C \equiv CC_2H_5$	Н	н	н	н
$CH_2C_6H_4-4-(CH_2)_3C \equiv CC_5H_{11}$	н	н	н	н
$CH_2C_6H_4-2-(CH_2)_3C \equiv CC_5H_{11}$	Н	н	Н	Н
$CH_2C_6H_{10}$ -4- $(CH_2)_3C \equiv CC_5H_{11}$	Н	н	н	н
$(CH_2)_2C_6H_4$ -3-C=CH	Н	н	н	н
$(CH_2)_2C_6H_4-4-C \equiv CH$	н	Н	Н	н
$(CH_2)_2C_6H_4-3-C \equiv CCH_3$	н	н	Н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4-4-C \equiv CCH_3$	н	Н	Н	н
$(CH_2)_2C_6H_4-4-(CH_2)_2C=CCH_3$	н	н	н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4$ -3- $(CH_2)_3C = CC_5H_{11}$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4$ -3- $C = CC_6H_{17}$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3C_6H_4-3-C \equiv CH$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3C_6H_4-4-C \equiv CH$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3C_6H_4-3-C \equiv CCH_3$	н	Н	н	Н
$CH(C_2H_5)C_6H_4-4-C \equiv CCH_3$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_3C_6H_4-3-(CH_2)_4C \equiv CC_4H_9$	н	н	Н	Н
$(CH_2)_3C_6H_4-2-C \equiv CC_8H_{17}$	н	н	н	н

R ¹	R²	R³	R⁴	, R ⁵
$CH_2CH(CH_3)C_6H_{10}-2-(CH_2)_3C = CC_5H_{11}$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3C_6H_4$ -4- $C = CC_8H_{17}$	н	Н	н	н
$CH_2CH(CH_3)C_6H_{10}-4-(CH_2)_3C \equiv CC_5H_{11}$	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C≡CH	н	Н	Ħ	н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C≡CH	н	Н	Н	н
$(CH_2)_4C_6H_4-3-C = CCH_3$	н	Н	. н	н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ C≡CH	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_4C_6H_4-3-C \equiv CC_8H_{17}$	н	Н	Н	н
$(CH_2)_4C_6H_4-4-(CH_2)_8C = CH$	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_4C_5H_8$ -4- $(CH_2)_8C \equiv CH$	н	Н	Н	н
CH₂CH=CHCH₂C5H6-4-(CH2)6C≡CH	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_5C_6H_4$ -3- $C\equiv CH$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C≡CH	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_5C_6H_4-2-C = CH$	н	Н	н -	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -2-C≡CH	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH3
(CH2)5C6H4-3-CH2C=CH	Н	Н	Н	Н
(CH2)5C6H4-4-C = CCH3	Н	Н	н	н
$(CH_2)_2CH(C_2H_5)C_6H_4-3-(CH_2)_2C = CC_6H_{13}$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_5C_6H_4-4-C \equiv CC_8H_{17}$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_7 C_6 H_4 - 3 - C = CH$	Н	Н	Н	Н
$(CH2)7C6H4-4-C \equiv CH$	Н	Н	Н	н
(CH2)7C6H4-3-CH2C=CH	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_7 C_6 H_4 - 3 - C = CCH_3$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3CH(C_3H_7)C_6H_4-3-(CH_2)_5C \equiv CC_3H_7$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_7C_6H_4-4-C \equiv CC_8H_{17}$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_7C_8H_{12}-4-(CH_2)_4C \equiv CC_4H_9$	Н	Н	Н	н
$C = C(CH_2)_3CH(CH_3)C_6H_4-4-C = CC_8H_{17}$	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H₄-4-OCH₃	Н	Н	Н	, н
C ₆ H ₄ ·3-OC₂H ₅	Н	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
C ₆ H₄-4-OC₃H₁	H	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -3-OC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н

R ¹	R ²	R ³	R⁴	. R⁵
C ₆ H ₄ -2-OC ₄ H ₉	н	н	Н	н
C ₆ H ₁₀ -3-OC ₄ H ₉	н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	н	Н	Н	н
C ₆ H ₄ -3-OC ₆ H ₁₃	Н	н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	Н	н	н	н
C ₆ H ₄ -4-OC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	н
C ₆ H ₄ -4-OC ₈ H ₁₇	COCH ₃	н	COCH₃	COCH ₃
C ₆ H ₄ -3-OC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	н
C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	. Н	Н	н	н
C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
C ₆ H ₄ -3-OC ₂ H ₂₅	Н	Н	н	н
C ₆ H ₄ -4-OC ₁₂ H ₂₅	Н	н	н	Н
C ₆ H ₄ -3-OC ₂₀ H ₄₁	Н	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-OC ₂₀ H ₄₁	н	Н	H·	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	Н	Н	н	н
CH2C6H4-3-OC2H5	н	Н	Н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-OC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₅ H ₁₁	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₅ H ₁₁	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₇ H ₁₅	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH3
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ CH=CH ₂	н	. н	н	Н
$CH_2C_6H_4-4-O(CH_2)_6CH=CH_2$	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₈ H ₁₇	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₈ H ₁₇	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₉ H ₁₉	Н	<u>H</u>	Н	Н

R¹	₽²	R³	R⁴	R⁵
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₉ H ₁₉	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
CH2C6H4-3-OC6H13	н	Н	Н	н
CH₂C₄H₄-4-OC₄H₃	н	H `	Н	Н
CH2C6H4-3-OC10H21	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₁ H ₂₃	н	н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH3
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₂ H ₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₃ H ₇	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₄ H ₉	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₅ H ₈ -3-OC ₄ H ₉	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₆ H ₁₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH3
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₇ H ₁₅	н	Н	н `	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₇ H ₁₅	COCH₃	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₇ H ₁₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₇ H ₁₅	COCH₃	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₈ H ₁₇	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₈ H ₁₇	COCH₃	Н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
CH=CHC ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₁ H ₂₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH3
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -2-OC ₁₂ H ₂₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₂ H ₂₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₂ H ₂₅	Н	Н	н	<u> </u>

R ^t	R²	R ³	R ⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₂₀ H ₄₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₂₀ H ₄₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₂ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	Н	Н	Н	·
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₃ H ₇	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₅ H ₁₁	Н	н	н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₅ H ₁₁	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₆ H ₁₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	, н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -2-OC ₁₀ H ₂₁	Н	н	н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₁ H ₂₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₂₂ H ₂₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₂ H ₂₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₂₀ H ₄₁	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₂₀ H ₄₁	н	Н	н	н
(CH ₂) ₃ C ₈ H ₁₄ -5-OC ₂₀ H ₄₁	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₂ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₄ H ₉		_н	н	н

R¹	R²	R ³	R⁴ ·	R⁵
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -3-OC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
CH2CH=CHCH2C6H4-4-OC10H21	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₂ H ₂₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₂ H ₂₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₂₀ H ₄₁	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₂₀ H ₄₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -2-OCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₃ H ₇	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OC ₄ H ₉	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OC ₆ H ₁₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	Н	Н	н	Н
$C \equiv C(CH_2)_3C_6H_4-3-OC_{10}H_{21}$	Н	Н	н	Н
$C = C(CH_2)_3C_6H_{10}-3-OC_{10}H_{21}$	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₂ H ₂₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₂ H ₂₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OC ₂₀ H ₄₁	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₂₀ H ₄₁	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	COCH₃	Н	COCH3	COCH
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-OC ₇ H ₁₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н .	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -2-OC ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -3-OC ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	Н

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	н	н	Н	н
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	н	н	н	н
C ₆ H ₄ -3-OCH=CH ₂	н	н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-OCH=CH ₂	н	н	H .	н
CH₂C₅H₄-3-OCH=CH₂	н	Н	Н	н
CH₂C₀H₄-4-OCH=CH₂	н	н	Н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ CH=CH ₂	н	н	Н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ CH=CH ₂	н	н	·H	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	н	н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₇ CH=CHCH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ CH=CH ₂	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ CH=CH ₂	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-OCH ₂ CH=CH ₂	н	н	н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4$ -3-O $(CH_2)_4CH=CHC_4H_9$	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ CH=CH ₂	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ CH=CH ₂	Н	н	н	H·
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	н	н	н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ CH=CHC ₂ H ₅	Н	н	н	Н
$(CH_2)_9C_6H_4$ -3-OCH $_2CH$ =CH $_2$	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ CH=CH ₂	н	н	н	н
$(CH_2)_9C_6H_4-3-O(CH_2)_4CH=CHC_4H_9$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_9C_6H_4-4-O(CH_2)_4CH=CHC_4H_9$	н	н	Н	н
C ₆ H ₄ -3-OC≡CH	н	Н	н	Н
$C_6H_4-4-OC \equiv CH$	н	Н	Н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OC≡CH	н	Н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC≡CH	н	н	Н	н
$CH_2C_6H_4$ -3-OC $H_2C \equiv CH$	н	н	н	Н
$CH_2C_6H_4-4-OCH_2C \equiv CH$	Н .	Н	Н	Н
$CH_2C_6H_4$ -3-O(CH_2) $_4C = CC_4H_9$	Н	н	Н	Н
$CH_2C_6H_4-4-O(CH_2)_4C = CC_4H_9$	Н	н	Н .	Н
$(CH_2)_2C_6H_4-3-OCH_2C = CH$	Н	Н	Н	н

R¹	R²	R³	R⁴	R ⁵
$(CH_2)_2C_6H_4-4-OCH_2C=CH$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2C_5H_8-2-OCH_2C = CH$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4-3-O(CH_2)_6C \equiv CC_2H_5$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4-4-O(CH_2)_4C \equiv CC_4H_9$	Н	н	н	н
$(CH_2)_3C_6H_4$ -3-OCH ₂ C = CH	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_3C_6H_4-4-OCH_2C = CH$	н	н	н	н
$(CH_2)_3C_6H_4$ -3- $O(CH_2)_2C = CC_6H_{13}$	н	н	н	Н
$(CH_2)_3C_6H_4-4-O(CH_2)_7C \equiv CCH_3$	н	н	н	Н
(CH2)4C6H4-2-OCH2C=CH	Н	Н	н	н
$(CH_2)_4C_6H_4$ -3-OCH ₂ C=CH	н	Н	н	Н
$(CH_2)_4C_6H_4-4-OCH_2C \equiv CH$	Н	н	н	Н
$(CH_2)_4C_6H_4-3-O(CH_2)_2C \equiv CC_6H_{13}$	н	. н	н	Н
$CH_2CH=CHCH_2C_6H_4-4-O(CH_2)_4C\equiv CC_4H_9$	н	Н	н	Н
$(CH_2)_5C_6H_4$ -3-OCH ₂ C \equiv CH	н .	Н	н	Н
$(CH_2)_2CH(C_2H_5)C_6H_4-4-OCH_2C=CH$	Н	Н	н	н
$(CH_2)_2CH(C_2H_5)C_6H_{10}-4-OCH_2C = CH$	Н	н	н	Н
$(CH_2)_5C_6H_4-3-O(CH_2)_5C \equiv CC_3H_7$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_5C_6H_4-4-O(CH_2)_4C \equiv CC_4H_9$	н	Н	н	Н
$(CH_2)_7C_6H_4$ -3-OCH $_2C = CH$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_7C_6H_4-4-OCH_2C=CH$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_7C_6H_4-3-O(CH_2)_5C = CC_3H_7$	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_2C \equiv C(CH_2)_3C_6H_4-4-O(CH_2)_7C \equiv CCH_3$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_9C_6H_4$ -3-OCH $_2C = CH$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_9C_6H_4-4-O(CH_2)_2C \equiv CCH_3$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_5CH(C_3H_7)C_6H_4-3-O(CH_2)_3C \equiv CC_5H_{11}$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_9C_6H_4-4-O(CH_2)_6C \equiv CC_2H_5$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{11}C_6H_4$ -3-OCH ₂ C=CH	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3C \equiv C(CH_2)_6C_6H_4-4-O(CH_2)_2C \equiv CCH_3$	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_{11}C_6H_4-2-O(CH_2)_2C \equiv CC_6H_{13}$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{11}C_6H_4$ -3- $O(CH_2)_2C \equiv CC_6H_{13}$	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_{11}C_6H_4-4-O(CH_2)_8C = CH$	Н	· H	Н	Н
$(CH_2)_{13}C_6H_4$ -3- $O(CH_2)_2C \equiv CC_2H_5$	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_{13}C_6H_4-4-O(CH_2)_2C \equiv CCH_3$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_4CH=CH(CH_2)_3C_6H_4-3-O(CH_2)_2C \equiv CC_6H_{13}$	Н	Н	Н	Н

R¹	R ²	R³	R⁴	R ⁵
$(CH_2)_{13}C_6H_4-4-O(CH_2)_8C = CH$	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ C ₆ H ₅	Н	н	н	н
C ₆ H ₁₀ -4-OCH ₂ C ₆ H ₅	н	н	н	н
C_6H_4 -4-O(CH ₂) ₂ C_6H_5	н	н	н	н
C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	Н	н	н	н
C ₆ H ₄ -2-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	н	н	н	н
C_6H_4 -4-O(CH ₂) ₄ C_6H_5	н	н	н	н
C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	н	н	н	н
C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	Н	н	н	н
C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₁₂ C ₆ H ₅	Н	н	Н	н
C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₁₄ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -2-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	Н	н	н	н ·
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	Н	н	н	н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_5CH(CH_3)C_6H_4-4-O(CH_2)_4C_6H_5$	н	н	н	Н
$CH_2CH = CHCH_2CH(C_2H_5)C_6H_4 - 4 - O(CH_2)_4C_6H_5$	Н	н	Н	Н
$CH_2CH=CHCH_2CH(C_2H_5)C_6H_{10}-4-O(CH_2)_4C_6H_5$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_3C = C(CH_2)_2C_6H_{10}-4-O(CH_2)_4C_6H_5$	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_4C_6H_4-4-O(CH_2)_8C_6H_5$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_5CH(CH_3)C_6H_4$ -4- $O(CH_2)_{10}C_6H_5$	Н	Н	н	н
$CH_2CH = CHCH_2CH(C_2H_5)C_6H_4 - 4 - O(CH_2)_{12}C_6H_5$	Н	Н	Н	Н
$CH_2CH \! = \! CHCH_2CH(C_2H_5)\!C_6H_{10} \! - \! 4-O(CH_2)_{13C_6H_5}$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3C = C(CH_2)_2C_6H_{10}-4-(CH_2)_3C_6H_5$	Н	н	Н	Н
(CH₂) ₁₁ C ₆ H₄-4-(CH₂) ₅ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-COCH ₃	Н	Н	Н	н
C ₆ H ₄ -4-COC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-COC ₅ H ₁₁	Н	н	Н	Н

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵
C ₆ H ₁₀ -4-COC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-COC ₁₃ H ₂₇	Н	н	н	Н
CH₂C₅H₄-2-COCH₃	н	н	Н	Н
CH₂C₀H₁₀-2-COCH₃	Н	Н	Н	Н
CH₂C₅H₄-3-COCH₃	Н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H ₁₀ -3-COCH₃	Н	н	Н	Н
CH₂C₀H₄-4-COCH₃	Н	Н	Н	Н
CH₂C₀H₁₀-4-COCH₃	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₂C ₆ H₄-4-COCH₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COC ₆ H ₁₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COC ₉ H ₁₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₅ H ₄ -4-COC ₁₀ H ₂₁	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-COC ₃ H ₇	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-COC ₉ H ₁₉	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-COC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3CH(CH_3)C_6H_4$ -3- COC_5H_{11}	Н	Н	Н	Н
CH=CHCH2CH(CH3)C6H4-3-COC5H11	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	Н	н	н	Н
(CH₂) ₇ C ₆ H₁₀-4-COCH₃	Н	Н	Н	Н
$CH_2C \equiv C(CH_2)_4C_6H_{10}-4-COCH_3$	Н	н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-COC ₇ H ₁₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -2-COC ₇ H ₁₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -3-COC ₇ H ₁₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-COC ₇ H ₁₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-COC ₇ H ₁₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-COC ₃ H ₇	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-COC ₂ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	н	Η,	Н	Н
$(CH2)10C \equiv CCH(CH3)C6H4-4-COCH3$	Н	.H	н	Н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-COC_7H_{15}$	н	Н	·H	Н
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-COC ₄ H ₉	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-COC ₉ H ₁₉	H	Н.	Н	<u>H</u>

R¹	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-COC ₉ H ₁₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-COC ₁₃ H ₂₇	Н	Н	н	Н
(CH₂)₂C ₆ H₄-4-COC₁7H ₃₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-COC ₁₈ H ₃₇	н	Н	н	н
C ₆ H ₄ -4-NHCOCH ₃	н	Н	н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-NHCOCH₃	н	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₂ H ₅	Н	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₅ H ₁ ,	Н	Н	н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-NHCOC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₁₃ H ₂₇	Н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-4-NHCOCH₃	н	н	н	Н
CH₂C₅H10-4-NHCOCH3	Н	н	Н	Н
CH₂C₅H₄-2-NHCOCH₃	Н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-3-NHCOCH₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₉ H ₁₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₉ H ₁₉	COOC(CH3)3	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₃ H ₇	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₄C ₆ H₄-4-NHCOCH₃	Н .	Н	Н	Н
$(CH_2)_3CH(CH_3)C_6H_4$ -3-NHCOC ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	Н
$CH = CHCH_2CH(CH_3)C_6H_4\text{-}3\text{-}NHCOC_5H_{11}$	Н	Н	Н	Н
(CH₂) ₇ C ₆ H₄-4-NHCOCH₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOCH ₃	Н	Н	Н	Н
$CH_2C = C(CH_2)_4C_6H_{10}-4-NHCOCH_3$	н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-4-NHCOC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-NHCOC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_6CH(C_4H_9)C_6H_4-4-NHCOC_2H_5$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-NHCOCH ₃	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-NHCOCH_3$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-NHCOC_7H_{15}$	Н	Н	Н	Н ·
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NHCOCH ₃	Н	Н	Н	Н

R ¹ .	R²	R³	R ⁴	R⁵
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₄ H ₉	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₉ H ₁₉	н	н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOC ₉ H ₁₉	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-NHCOC ₁₃ H ₂₇	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₁₇ H ₃₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₁₈ H ₃₇	Н	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	Н	н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-⊙COCH ₃	н	Н	н	н
C ₆ H ₄ -4-OCOC₂H ₅	н	н	н	Н
C ₆ H ₄ -2-OCOC ₅ H ₁₁	Н	н	Н	н
C ₆ H ₄ -4-OCOC ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-OCOC ₇ H ₁₅	Н	н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-OCOC ₁₃ H ₂₇	н	н	Н	Н
CH₂C₅H₄-4-OCOCH₃	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-OCOCH ₃	н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-3-OCOCH₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₃ H ₇	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-OCOC ₃ H ₇	Н	н	Н	Н
(CH₂)₄C ₆ H₄-4-OCOCH₃	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_3CH(CH_3)C_6H_4$ -3-OCOC $_5H_{11}$	Н	н	Н	Н
$CH = CHCH_2CH(CH_3)C_6H_4 - 3 - OCOC_5H_{11}$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-OCOCH ₃	Н	Н	Н	H
$CH_2C \equiv C(CH_2)_4C_6H_{10}-4-OCOCH_3$	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-OCOC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OCOC ₇ H ₁₅	Н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₇ H ₁₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-OCOC ₇ H ₁₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₃ H ₇	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_6CH(C_4H_9)C_6H_4-4-OCOC_2H_5$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -2-OCOCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -3-OCOCH ₃	H	Н	Н	Н

WO 94/08943

R¹	R²	R³	. R⁴	R⁵
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-OCOCH_3$	н	н	н	Н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-OCOC_7H_{15}$	н	н	н	н
(CH ₂) _H CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	н	н	H	н
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₄ H ₉	н	н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₉ H ₁₉	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-OCOC ₉ H ₁₉	Н	н	н	Н
$(CH_2)_6CH(CH_3)C_6H_{10}-4-OCOC_{13}H_{27}$	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₁₇ H ₃₅	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₁₈ H ₃₇	Н	н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	н	Н	н	н
C ₆ H ₁₀ -4-COOCH ₃	Н	н	н	H
C ₆ H ₄ -4-COOC ₂ H ₅	н	н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-COOC ₄ H ₉	н	н	н	н
C ₆ H ₁₀ -2-COOC ₈ H ₁₇	н	н	н	н
C ₆ H ₁₀ -3-COOC ₈ H ₁₇	н	· н	н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-COOC ₈ H ₁₇	н	н	н	Н
C ₆ H₄-4-COOC₁₄H₂	н	н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	Н	н	н	Н
$\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_{10}\text{-4-COOCH}_3$	Н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-COOCH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3C_6H_4$ -4-COOC ₄ H_9	Н	H	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-COOC ₄ H ₉	н	Н	н	Н
$(CH_2)_4C_6H_4$ -4-COOCH ₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-COOC ₆ H ₁₃	н	н	Н	Н
$CH = CHCH_2CH(CH_3)C_6H_4\text{-}3\text{-}COOC_6H_{13}$	н	н	Н	Н
$(CH_2)_7C_6H_4$ -2-COOCH ₃	н	н	н	Н
$(CH_2)_7C_6H_4$ -3-COOCH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_7C_6H_{10}$ -4-COOCH ₃	н	Н	Н	Н
$CH_2C = C(CH_2)_4C_6H_{10}-4-COOCH_3$	Н	н	Н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-COOC ₈ H ₁₇	H	Н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-COOC ₈ H ₁₇	н	Н	Н	н

96

R¹	₽²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-COOC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-COOC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-COOC ₃ H ₇	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-COOCH_3$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-COOC_8H_{17}$	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-COOC ₅ H ₁₁	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-COOC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-COOC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_8CH(CH_3)C_6H_{10}$ -4-COOC ₁₄ H ₂₉	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COOC ₁₈ H ₃₇	н	Н	· H	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -2-COOC ₁₉ H ₃₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-COOC ₁₉ H ₃₉	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-COOC ₁₉ H ₃₉	Н	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH ₃	Н	Н	н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOCH ₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -2-NHCOOC ₂ H ₅	Н	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -3-NHCOOC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOC ₈ H ₁₇	Н	н	Н	н
C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₁₄ H ₂₉	н	Н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOCH ₃	Н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-NHCOOCH ₃	Н	н	н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4$ -2-NHCOOCH ₃	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4$ -4-NHCOOCH ₃	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3C_6H_4$ -4-NHCOOC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOC₄H ₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH ₃	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3CH(CH_3)C_6H_4$ -3-NHCOOC $_6H_{13}$	Н	Н	Н	Н
CH=CHCH₂CH(CH₃)C₀H₄-3-NHCOOC₀H₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂),C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH₃	Н	Н	Н	Н

:

R ^t	R ²	R ³	R ⁴	R⁵
(CH₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOCH ₃	н	Н	н	Н
$CH_2C \equiv C(CH_2)_4C_6H_{10}$ -4-NHCOOCH ₃	н	н	н	н
CH₂C₅H₄-4-NHCOOC₅H₁7	н	н	н	н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₈ H ₁₇	н	н	н	н
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₇ -4-NHCOOC ₈ H ₁₇	н	н	' н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₄ H ₉	Н	. н	Н	Н
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₃ H ₇	н	Н	Н	Н
(CH₂) ₁₃ C ₆ H₄-4-NHCOOCH₃	Н	Н	н	н
$(CH2)10C \equiv CCH(CH3)C6H4-4-NHCOOCH3$	н	Н	н	Н
$(CH_2)_{t0}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-NHCOOC_8H_{17}$	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₅ H ₁₁	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_9C_6H_4$ -4-NHCOOC $_{10}H_{21}$	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOC ₁₀ H ₂₁	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_6CH(CH_3)C_6H_{10}-4-NHCOOC_{14}H_{29}$	н	Н	Н	H
(CH₂)₂C₅H₄-4-NHCOOC₁8H₃	Н	Н	* H	·H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₁₉ H ₃₉	н	Н	• н	, H
C ₆ H₄-4-NHCH₃	Н	Н	H,	Н
C ₆ H ₁₀ -4-NHCH ₃	н	Н	. Н	Н
C ₆ H ₄ -4-NHC ₂ H ₅	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-NHC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
C_6H_{10} -4-NH C_8H_{17}	Н	Н	Н	н
C ₆ H ₄ -4-NHC ₁₄ H ₂₉	Н	Н	Н	Н
CH₂C₀H₄-4-NHCH₃	н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₁₀-4-NHCH₃	Н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-3-NHCH₃	· H	Н	. Н	Н
$CH_2C_6H_4-4-N(CH_3)C_{10}H_{21}$	Н	Н	Н	Н
$CH_2C_6H_4-4-N(CH_3)C_{10}H_{21}$	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH3
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	H.	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NHC ₄ H ₉	Н	Н	Н	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-NHC₄H ₉	н	Н	·H	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	Н .	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -2-NHC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	<u> </u>

R¹	R²	R ³	R⁴	R ⁵
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NHC ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	Н
CH=CHCH₂CH(CH₃)C₄H₄-3-NHC₄H₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-NHCH ₃	Н	Н	Н	Н
$CH_2C \equiv C(CH_2)_4C_6H_{10}-4-NHCH_3$	Н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-4-NHC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NHC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-NHC ₈ H ₁₇	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-NHC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-NHC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{10}C = CCH(CH_3)C_6H_4-4-NHCH_3$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{10}C = CCH(CH_3)C_6H_4-4-NHC_8H_{17}$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-NHC ₅ H ₁₁	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NHC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-NHC ₁₀ H ₂₁	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-NHC ₁₄ H ₂₉	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHC ₁₈ H ₃₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NHC ₁₉ H ₃₉	н	H	Н	Н
C ₆ H₄-4-SCH₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-SCH ₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-SC ₂ H ₅	н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-SC ₄ H ₉	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-SC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-SC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-SC ₈ H ₁₇	COCH₃	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-SC ₁₄ H ₂₉	H	Н	Н	н
CH₂C ₆ H₄-2-SCH₃	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-SCH ₃	н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-SCH ₃	Н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H ₁₀ -4-SCH ₃	Н	н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-SC ₇ H ₁₅	н	Н	Н	Н
CH₂C₅H₄-4-SC₁H₅	COCH₃	Н	COCH₃	COC

WO 94/08943

R¹	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH₂)₂C ₆ H₄-4-SCH₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-SC ₄ H ₉	н	Н	н	. н
(CH₂)₃C₅H₁₀-4-SC₄H₃	н	н	н	Н
(CH₂)₄C₅H₄-4-SCH₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-SC ₆ H ₁₃	н	н	н	Н
CH=CHCH2CH(CH3)C6H4-3-SC6H13	н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-SCH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-SCH ₃	н	н	н	Н
$CH_2C \equiv C(CH_2)_4C_6H_{10}-4-SCH_3$	н	н	н	Н
CH₂C ₆ H₄-4-SC ₈ H ₁₇	н	н	н	н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-SC ₈ H ₁₇	н	н	н	Н
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-SC ₈ H ₁₇	Н	н	Н	Н
(CH₂)₁1C ₆ H₄-4-SC₄H₃	н	н	Н	н
$(CH_2)_6CH(C_4H_9)C_6H_4-4-SC_3H_7$	н	н	Н	Н
(CH₂)₃C₀H₄-4-SCH₃	Н	н	Н	Н
(CH2)10C = CCH(CH3)C6H4-4-SCH3	н	н	Н	Н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-SC_8H_{17}$	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-SCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-SC ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-SC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-SC ₁₀ H ₂₁	н	н	Н	Н
$(CH_2)_8CH(CH_3)C_6H_{10}-4-SC_{14}H_{29}$	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-SC ₁₈ H ₃₇	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-SC ₁₉ H ₃₉	Н	н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	н	Н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-CONHCH ₃	Н	н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-CONHC₂H ₅	н	н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-CONHC ₄ H ₉	Н	н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-CONHC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-CONHC ₁₄ H ₂₉	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H ₁₀ -4-CONHCH₃	н	Н	н	Н
CH₂C ₆ H ₄ -2-CONHCH₃	Н	н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-3-CONHCH₃	Н	Н	Н	Н .

R'	R²	R ³	R⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₄ H ₉	н	н	н	Н
(CH₂)₃C ₆ H ₁₀ -4-CONHC₄H₃	н	н	н	Н
(CH₂)₄C ₆ H₄-4-CONHCH₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-CONHC ₆ H ₁₃	н	н	Н	Н
CH=CHCH2CH(CH3)C6H4-3-CONHC6H13	н	н	н	Н
(CH₂) ₇ C ₆ H₄-4-CONHCH₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-CONHCH ₃	Н	Н	н	Н
CH2C = C(CH2)4C6H10-4-CONHCH3	Н	. Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₈ H ₁₇	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-CONHC ₈ H ₁₇	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₄ H ₉	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_6CH(C_4H_9)C_6H_4-4-CONHC_3H_7$	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	н	Н	Н	Н
(CH2)10C = CCH(CH3)C6H4-4-CONHCH3	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4$ -4-CONHC ₈ H ₁₇	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_9C_6H_4$ -4-CONHC $_{10}H_{21}$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-CONHC ₁₀ H ₂₁	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-CONHC ₁₄ H ₂₉	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4$ -4-CONHC $_{18}H_{37}$	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₁₉ H ₃₉	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-CH₂Br	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-CH₂Br	Н	Н	Н	Н
C ₆ H₄-2-CH₂Br	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -3-CH ₂ Br	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ F	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₄ Cl	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₂ CHFC ₃ H ₇	Н	Н	Н	Н
$C_6H_4-4-(CH_2)_7CHB_7C_6H_{13}$	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ Br	Н	Н	Н.	Н
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -2-CF ₃	Н	Н	Н	Н

R ^t	R²	R ³	R⁴	R ⁵
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -3-CF ₃	Н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H ₁₀ -4-CF₃	н	Н	н	н
CH₂C₅H₄-4-CH₂CI	н	н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-CH ₂ Br	Н	Н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ F	н	Н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ F	COCH3	Н	COCH₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CF ₂ C ₇ H ₁₅	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CF ₂ C ₇ H ₁₅	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ Br	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ Br	н	Н	н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₄ Br	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ Cl	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-CH ₂ Br	н	Н	н	H
CH=CHCH2CH(CH3)C6H4-3-(CH2)2CHClC3H7	н	Н	н	н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ F	н	Н	н	н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-CH ₂ Br	н	Н	н	٠н
$CH_2C \equiv C(CH_2)_4C_6H_{10}-4-CH_2Br$	н	Н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ CHFC ₄ H ₉	н	Н	н	н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CHClC ₂ H ₅	н	н	н	н
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-(CH ₂) ₅ CHClC ₂ H ₅	Н	Н.	н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₄ Cl	н	Н	н	н
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -2-CH ₂ CHBrCH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ Br	н	Н	Н	н
$(CH_2)_{10}C = CCH(CH_3)C_6H_4-4-CH_2Br$	н	Н	Н	н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-3-(CH_2)_3CHFC_4H_9$	Н	Н	Н	н
(CH₂) _M CH(CH₃)C ₆ H₄-4-CH₂Br	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{17}C_6H_4-4-(CH_2)_2CHCIC_2H_5$	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₁₀ Cl	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₇ CHClC ₂ H ₅	н	H,	н	н
(CH ₂) ₆ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -3-(CH ₂) ₃ CHFC ₁₀ H ₂₁	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4$ -3- $(CH_2)_9CBr_2C_8H_{17}$	н	Н	н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₈ CF ₃	Н	н	н	н
C ₆ H ₄ -4-NH ₂	Н	н	н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-NH ₂	`н	Н	Н	. Н

R¹	R²	R³	R ⁴	R⁵
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	Н	Н	н	н
CH₂C₅H w-4-NH₂	Н	Н	н	н
CH₂C ₆ H₄-3-NH₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -2-NH ₂	H,	Н	H	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-NH ₂	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-NH ₂	Н	Н	н	Н
CH=CHCH₂CH(CH₃)C6H₄-3-NH2	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -2-NH ₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-NH ₂	Н	Н	н	Н
$CH_2C \equiv C(CH_2)_4C_6H_{10}-4-NH_2$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-NH ₂	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	Н	Н	, н	Н
(CH ₂) ₆ CH(C₄H ₉)C ₆ H ₄ -4-NH ₂	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{10}C = CCH(CH_3)C_6H_4-4-NH_2$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3CH[(CH_2)_6C \equiv CC_2H_5]C_6H_4-4-NH_2$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NH ₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	н	Н	Н	H
CH ₂ CH(C ₇ H ₁₅)C ₆ H ₁₀ -4-NH ₂	Н	Н	Н	Н
(CH₂) ₈ CH(CH₃)C ₆ H ₁₀ -4-NH₂	Н	Н	Н	Н
C ₆ H₄-4-NO₂	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-NO ₂	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-NO ₂	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-NO ₂	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4-4-NO_2$	Н	Н	Н	H·
$(CH_2)_2C_6H_4-4-NO_2$	COCH3	Н	Н	Н
$(CH_2)_3C_6H_4-4-NO_2$	H	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-NO ₂	Н	Н	Н	н

R¹	R²	R ³	R ⁴	R⁵
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NO ₂	Н	Н	н	Н
CH=CHCH₂CH(CH₃)C ₆ H₄-3-NO₂	Н	Н	Н	Н
(CH₂)-C ₆ H₄-4-NO₂	Н	Н	н	Н
(CH ₂)-C ₆ H ₁₀ -4-NO ₂	Н	Н	Н	Н
$CH_2C = C(CH_2)_4C_6H_{10}-4-NO_2$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-NO ₂	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	Н	Н	н	Н
(CH₂) ₆ CH(C₄H ₉)C ₆ H₄-4-NO₂	Н	Н	Н	Н
(CH₂) ₁₃ C ₆ H₄-4-NO₂	Н	Н	Н	·H
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-NO_2$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3CH[(CH_2)_6C = CC_2H_5]C_6H_4-4-NO_2$	н	Н	Н.	н
(CH ₂) ₁₄ C≡CC ₆ H ₄ -3-NO ₂	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	Н	Н	Н	Н
CH₂CH(C₂H₁₅)C ₆ H₁₀-4-NO₂	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-NO ₂	Н	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-OH	н	Н	Н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-OH	Н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-4-OH	Н	Н	Н	Н
CH₂C ₆ H₄-4-OH	COCH₃	н	COCH ₃	COCH ₃
CH₂C ₆ H₁₀-4-OH	Н	Н	Н	Н
CH₂C₅H₄-3-OH	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OH	Н	Н	H	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H₄-4-OH	Н	Н	Н	H
$(CH_2)_3C_6H_{10}$ -4-OH	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₄C ₆ H₄-4-OH	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-OH	Н	Н	Н	Н
CH=CHCH2CH(CH3)C6H4-3-OH	Н	Н	Н	Н
(CH₂) ₇ C ₆ H₄-4-OH	Н	. H	Н	Н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-OH	Н	Н	Н	Н
$CH_2C \equiv C(CH_2)_4C_6H_{10}-4-OH$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -2-OH	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-OH	н	н	Н	Н

R¹	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₉ C ₈ H _M -4-OH	, H	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-OH	н	н	н	Н
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-OH	н	н	н	Н
(CH₂) _{t3} C ₆ H₄-4-OH	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-OH$	Н	н	н	Н
$(CH_2)_3CH[(CH_2)_6C \equiv CC_2H_5]C_6H_4-4-OH$	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-OH	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-OH	н	н	н	Н
CH ₂ CH(C,H ₁₅)C ₆ H ₁₀ -4-OH	н	н	н	Н
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-OH	н	н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-COOH	н	н	н	Н
C ₆ H ₁₀ -4-COOH	Н	Н	н	Н
CH₂C₀H₄-4-COOH	н	н	н	Н
CH₂C₀H₀-4-COOH	н	н	н	н
CH₂C₄H₄-3-CÖOH	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COOH	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-COOH	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-COOH	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-COOH	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-COOH	н	н	н	Н
CH=CHCH2CH(CH3)C6H4-2-COOH	Н	н	н	Н
CH=CHCH2CH(CH3)C6H4-3-COOH	Н	н	н	н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-COOH	Н	н	н	Н
(CH₂) ₇ C ₆ H₁0-2-COOH	н	н	Н	н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -3-COOH	Н	н	н∙	Н
(CH₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-COOH	Н	Н	н	н
$CH_2C = C(CH_2)_4C_6H_{10}-4-COOH$	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-COOH	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-COOH	Н	H ·	н .	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H₄-4-COOH	н	H	Н	Н
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-COOH	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-COOH	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-COOH$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_3CH[(CH_2)_6C = CC_2H_5]C_6H_4-4-COOH$	H (05	Н	Н	Н

105

R¹	R ²	R ³	R ⁴	R⁵
(CH ₂) ₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-COOH	н	<u></u> н	Н	<u></u> Н
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-COOH	н	н	H	н
CH ₂ CH(C ₂ H ₁₆)C ₆ H ₁₀ -4-COOH	н	н	н	н
(CH ₂) ₆ CH(CH ₃)C ₆ H ₃ -4-COOH	 Н	н	'Н	н
C ₆ H ₄ -4-Br	н	н	'' H	н
	н	'' H	'' H	н
C ₆ H ₁₀ -4-Cl	Н	Н	Н	Н
CH₂C₅H₄-4-Br CH₂C₅H₁₀-4-Cl	Н	Н	n H	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Cl	н	н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-F	н	н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-F		н		
CH₂C₀H₄-3-F	Н	н	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-Br	н	н	н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-F	н	н	н	• н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-Cl	н	н	н	н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-Cl	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-Br	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-Br	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-I	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -2-Br	н	н	н	н
(CH₂)₃C₅H₁₀-4-Br	н	н	н	н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-F	н	н	н	н
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -2-Br	н	н	н	н
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-Br	Н	н	н	н
CH=CHCH₂CH(CH₃)C ₆ H₄-3-Br	н	н	н	н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-F	н	н	Н	н
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-Br	н	н	н	н
$CH_2C = C(CH_2)_4C_6H_{10}-4-Br$	н	н	н	н
(CH ₂) ₉ C ₆ H₄-4-F	н	н	н	н
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-F	н	Н	H .	н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-Br	Н	Н	н	1H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-F	н	н	н	н
(CH₂) _{t3} C ₆ H₄-2-Br	н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H₄-4-Br	Н	Н	Н	Н

106

R¹	R²	R ³	R⁴	R⁵
$(CH_2)_{10}C \equiv CCH(CH_3)C_6H_4-4-CI$	н	Н	н	Н
$(CH_2)_3CH[(CH_2)_6C = CC_2H_5]C_6H_4-4-Br$	н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-CI	н	Н	Н	Н
(CH₂)₁7C ₆ H₄-4-Br	н	Н	н	Н
CH₂CH(C ₇ H ₁₅)C ₆ H ₁₀ -4-F	н	Н	н	н -
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-Cl	н	н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₃ (-4-NH ₂)-3-Cl	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₉ (-4-NH ₂)-2-CH ₃	н	Н	H	Н
CH₂C₀H₃(-2-NHCOCH₃)-4-OCH₃	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_3C_6H_9(-4-COOC_2H_5)-3-C_{10}H_{21}$	н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₂ (-4-Br)(-3-C ₂ H ₅)-2-COOH	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₂ (-3-C ₄ H ₉)(-2-F)-4-NO ₂	н	н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₃ (-3-F)-4-C ₈ H ₁₇	Н	Н	н	Н
CH₂C₀H₃(-3-F)-4-C₀H₁₁	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH₃
CH ₂ C ₆ H ₃ (-2-C ₂ H ₅)-4-C ₈ H ₁₇	Н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₃ (-2-C ₂ H ₅)-4-C ₆ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH3
CH ₂ C ₆ H ₃ (-3-CH ₃)-4-C ₆ H ₁₇	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₃ (-3-CH ₃)-4-C ₆ H ₁₇	COCH3	Н	COCH₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₃ (-4-OC ₇ H ₁₅)-3-OCH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₃ (-4-OC ₇ H ₁₅)-3-OCH ₃	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₃ (-4-OC ₇ H ₁₅)-3-CH ₃	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₃ (-4-OC ₇ H ₁₅)-3-CH ₃	COCH3	Н	COCH₃	COCH3
$ \begin{array}{c} O \\ O \end{array} $ $ \begin{array}{c} C_6H_{13} \end{array} $	Н	н	н	н
$ \begin{array}{c} O \\ O \end{array} $ $ \begin{array}{c} CGH_2)_7 \\ C_6H_{13} \end{array} $	COCH₃	н	COCH ₃	COCH ₃
$ \begin{array}{c c} O & C_{10}H_{21} \\ O & (CH_2)_3 - C_{10}H_{21} \end{array} $	н	н	н	н
$O \longrightarrow C_{10}H_{21}$ (CH ₂) ₃ —	COCH ₃	н	COCH₃	COCH ₃

R¹	R²	R ³	R ⁴	R ⁵
O (CH ₂) ₂ — C ₇ H ₁₅	н	н	Н	н
C_{O} $C_{7}H_{15}$	COCH3	н	COCH ₃	COCH ₃
O (CH ₂) ₂ — C ₈ H ₁₇	н	н	н	н
O (CH ₂) ₂ — C ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₆ COC ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	Н	Н	· H	н
COC ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	Н	Н	н	н
COC ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH ₃
COC ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	Н	Н	н	н
COC ₆ H₄-4-C ₈ H₁ ₇	COCH₃	н	COCH₃	COCH3
CH(OH)C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	Н	Н	н	H
CH(OH)C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
CH(OH)C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	н	н	н	н
CH(OH)C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH3
(CH ₂) ₅ OC ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₅ OC ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	COCH₃	Н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₇ F	Н	Н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₇ F	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCF ₂ C ₆ H ₁₃	Н	н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCF ₂ C ₆ H ₁₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH₂) ₈ OC ₆ H ₅	н	н	Н	н
(CH₂)₅OC₅H₅	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH3
(CH ₂) ₁₁ OC ₆ H ₅	COCH₃	Н	н	н
(CH ₂) ₁₁ OC ₆ H ₅	н	н	н	н
(CH ₂) ₅ O(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₅ O(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	COCH3	Н	COCH₃	COCH ₃
	н	н	н	н
CH2C6H4OCH2C6H5	COCH3	Н	COCH₃	COCH ₃
$CH_2C_6H_4O(CH_2)_6C_6H_5$	Н	Н	н	н

108

R¹	R²	R ³	R⁴	R ⁵
	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH₃
CH ₂ C ₆ H ₄ CH ₂ O(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	н	Н	Н	н
CH2C4H4CH2O(CH2)5C4H5	COCH ₃	Н	COCH3	COCH ₃

CH₂OR⁴ R²R³N−C−CH₂OR⁵ R

R	R²	R³	R ⁴	R⁵
OH NH; OH	н	Н	Н	н
OH NHE OH	н	н	н	н
OH NAF OH	н	Н	Н	Н
OH N#. OH.	н	Н	н	Н
OH OH OH	н	н	н	н
OH OH	н	н	н	н
OH OH	Н	н	Н	. H
он он	н	н	н	Н
OH OH OH OH	Н	н	н	н
OH 04	Н	н	н	н
он он	н	н	н	н
он он	. н	н	н	н
OH OH	н	н	Н	н

110

CH₂OR⁴ R²R³N-C-CH₂OR⁵ R

R	R²	R³	R⁴	R⁵
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ CH ₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ CH ₃	н	Н	н	н
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	Н	Н	н	н
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	н	Н	Н	н
C ₆ H₄-4-(CH₂) ₇ CH₃	Н	H	н	Н
C ₆ H₄-4-(CH₂) ₈ CH₃	Н	Н	н	н
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	Н	н	н	н
C ₆ H₄-4-(CH₂) ₁₀ CH₃	Н	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	Н	н	Н	н
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ CH ₃	Н	н	н	н
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	н	н	н	н
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₄ CH ₃	, н	Н	Н	н
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₅ CH ₃	Н	Н	н	н
C ₆ H ₄ -2-(CH ₂) ₉ CH ₃	Н	Н	н	н
C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₉ CH ₃	Н	Н	н	, H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₃ CH ₃	н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₄ CH ₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ CH ₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ CH ₃	Н	Н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ CH ₃	н	Н	н	н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ CH ₃	н	н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₉ CH ₃	н	Н	Н	н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	Н	Н	Н	H·
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	Н	Н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₄ CH ₃	н	Ή	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₄ CH ₃	н	н	н	Н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₉ F	Н	н	Н	Н
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₃ F	Н	H	Н	Н

111

R	R²	R ³	R ⁴	R⁵
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₅ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH₂C₀H₄-4-S-(CH₂)₀CH₃	Н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₉ CH ₃	. Н	Н	Н	Н
$CH_2C_6H_4$ -4-S-(CH_2) $_{10}CH_3$	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	Н	н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	Н	н	н	н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₅ CH ₃	· H	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=0)(CH ₂) ₆ CH ₃	Н	н	н	Н
CH2C6H4-4-S(=0)(CH2)7CH3	н	н	н	Н
CH2C6H4-4-S(=O)(CH2)7CH3	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₆ CH ₃	н	н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₉ CH ₃	Н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₁₀ CH ₃	н	Н	н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₁₁ CH ₃	н	н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₁₂ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₁₃ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₅ CH ₃	Н	н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₆ CH ₃	Н	н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₇ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₇ CH ₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₉ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₁₁ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₁₂ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₁₃ CH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₆ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₆ CH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4:S(=O) ₂ (CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	н	H	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH ₃

1/2

R	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₈ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH3	н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₈ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₄ CH ₃	COCH3	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	COCH ₃	н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ F	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ F	COCH₃	н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ F	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ F	COCH3	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ F	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ F	COCH₃	Н	COCH ₃ .	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ F	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ F	COCH3	н	COCH ₃	COCH3
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₁ F	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₁ F	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₄ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	н	Н	Н	Ĥ
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	Н	Н	н .	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	н	.H	н.	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH3	COCH
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₅	H // 2	Н	Н	H

113

R	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH₂) ₁₅ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₁ ₇ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH₂) ₉ C ₆ H₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ C ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-F	н	Н	Н	Н
(CH₂) ₁₀ C ₆ H ₄ -3-F	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₄ -3-F	COCH₃	Н	COCH3	COCH₃
(CH₂)₁1C₀H₄-4-F	н	Н	н	н
(CH₂)ゼCgH₄-4-F	н	н	н	н
(CH₂) ₁₃ C₅H₄-4-F	н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₄ -4-F	COCH₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₄ C ₆ H ₄ -4-F	н	н	н	н
(CH ₂) ₁₅ C ₆ H ₄ -4-F	н	н	Н	н
(CH ₂) ₁₆ C ₆ H ₄ -4-F	н	н	Н	н
(CH ₂),,C ₆ H₄-4-F	н	н	н	н
(CH ₂) ₁₈ C ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₉ C ₆ H₄-4-F	н	н	Н	н
(CH₂) ₂₀ C ₆ H₄-4-F	н	н	н	н
$(CH_2)_6O(CH_2)_2C_6H_5$	н	Н	н	• н
$(CH_2)_6O(CH_2)_2C_6H_5$	COCH3	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₈ OCH ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₈ OCH ₂ C ₆ H ₅	COCH3	н	COCH ₃	COCH ₃
$(CH_2)_2C_6H_4$ -4- $OCH_2C_6H_5$	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_2C_6H_4$ -4-OCH $_2C_6H_5$	COCH ₃	Н	COCH3	COCH ₃
$(CH_2)_2C_6H_4-4-O-(CH_2)_2C_6H_5$	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	Н	H.	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₃ OC ₆ H ₅	н	H	н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4-4-O-(CH_2)_4OC_6H_5$	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ OC ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ OC ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н

R	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ OC ₆ H ₅	H	Н	н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4$ -4-O- $(CH_2)_8OC_6H_5$	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ OC ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2C_6H_4-4-(CH_2)_4OC_6H_5$	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ OC ₆ H ₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ OC ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ OC ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ OC ₆ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-F	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-F	н	Н	\mathbf{H}_{i}	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-F	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₄ -4-F	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₄ -4-F	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-F	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₄ -4-F	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ C ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-F	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-F	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-F	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-F	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₄ -4-F	Н	н	Н	Ĥ
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₃ OC ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₄ OC ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ OC ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ OC ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ OC ₆ H ₄ -4-F	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ OC ₆ H ₄ -4-F	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ OC ₆ H ₄ -4-F	H	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ OC ₆ H ₄ -4-F	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ OC ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ OC ₆ H ₄ -4-F	Н	н	н	Н

R	R²	R³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ OC ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	Н	Н
(CH2)2C6H4-4-(CH2)8OC6H4-4-F	Н	Н	Н	Н
CH₂CH(OH)C ₆ H₄-4-(CH₂)₅CH₃	H	Н	Н	Н
$CH_2CH(OH)C_6H_4-4-(CH_2)_6CH_3$	Н	Н	Н	Н
CH ₂ CHFC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ CHFC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH
CH2CHFC6H4-4-(CH2)8CH3	н	Н	Н	Н
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	н	Н	н	н
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	н	н	н	Н
CH2CH(OH)C6H4-4-(CH2)11CH3	н	н	н	Н
CH2CH(OH)C6H4-4-(CH2)11CH3	COCH₃	н	COCH₃	COCH
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	н	н	н	н
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	н	н	н	н
CH(OH)CH(OH)C6H4-4-(CH2)5CH3	н	н	н	Н
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	н	н	н	н
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	Н	Н	В	н
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	н	н	н
CH(OH)CH(OH)C6H4-4-(CH2)9CH3	Н	Н	н	н
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	н	н	н
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	Н	Н	н	н
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂₂ CH ₃	н	Н	н	Н
CH(OH)CH₂C ₆ H ₅	н	Н	Н	н
CH(OH)CH2C6H4-4-(CH2)5CH3	н	Н	Н	н
CH(OH)CH2C6H4-4-(CH2)6CH3	н	Н	Н	н
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH ₃	Н	н	н
CH(OH)CH2C4H4-4-(CH2)7CH3	н	Н	н	н
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH₃	Н	н	н
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	Н	н	н
CH(OH)CH2C6H4-4-(CH2)9CH3	Н	Н	н	н
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	Н	н	н
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁ ,CH ₃	Н	Н	н	н
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	. COCH₃	Н	COCH ₃	COCH

R	R²	R ³	R⁴	R ⁵
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	Н	Н	Н	Н
$CH(OH)CH_{2}C_{6}H_{4}\text{-}4\text{-}O\text{-}(CH_{2})_{6}C_{6}H_{5}$	н	Н	Н	Н
$[CH(OH)]_2C_6H_4-4-O-(CH_2)_6C_6H_5$	Н	Н	Н	Н
$CH_2CH(OH)C_6H_4-4-O-(CH_2)_6C_6H_5$	Н	Н	н	Н
$CH(OH)CH_2C_6H_4-4-O-(CH_2)_6C_6H_5$	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
[CH(OH)] ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH ₃
CH2CH(OH)C6H4-4-O-(CH2)6C6H5	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	Н	Н	Н	н
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	Н	н	н	н
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	Н	н	Н	н
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH ₃
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	н	н	н	Н
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	н	н	н	Н
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	н	н	Н	Н
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	н	Н	н	Н
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH₃	н	COCH₃	COCH
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	н	Н	н	н
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	Н	Н	Н	н
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ CH ₃	н	. н	Н	Н
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	н	Н	н	Н
CH2CH=CHCH2C6H4-4-(CH2)5CH3	COCH₃	Н	COCH₃	COCH
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	н	н	н	Н
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂),CH ₃	н	Н	Н	Н
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	н	Н	Н	Н
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	н	Н	Н	Н
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	н	Н	н	Н
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	н	Н	Н	н
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH3	COCH
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	н	н	н

R	R²	R³	R⁴	R⁵
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂₀ CH ₃	н	Н	Н	Н
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	Н	Н	н	Н
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	Н	н	н	Н
$CH_2OC_6H_4-4-(CH_2)_{13}CH_3$	Н	н	н	н
CH₂OCH₂C ₆ H₅	Н	н	н	н
CH ₂ OCH ₂ C ₆ H ₅	COCH₃	Н	COCH₃	COCH₃
$CH_2OCH_2C_6H_4-4-(CH_2)_6CH_3$	Н	Н	н	н
CH ₂ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	н	Н	н	н
CH2O(CH2)3C6H4-4-(CH2)4CH3	н	н	Н	н
$CH_2O(CH_2)_4C_6H_4$ -4-(CH_2) $_3CH_3$	Н	н	Н	н
$CH_2O(CH_2)_5C_6H_4-4-(CH_2)_2CH_3$	Н	н	н	н
CH2O(CH2)6C6H4-4-CH2CH3	Н	н	н	н
CH ₂ O(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-CH ₃	Н	н `	н	н
CH ₂ O(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
CH ₂ O(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
$CH_2OC_6H_4$ -4- $O(CH_2)_4C_6H_5$	Н	Н	Н	н
$CH_2OC_6H_4$ -4-O(CH_2) $_5C_6H_5$	Н	Н	Н	. н
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	· H	COCH₃	COCH3
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ C ₆ H ₄ -4-F	Н	Н	н	н
CH2OC6H4-4-O(CH2)7C6H5	Н	Н	н	н
$CH_2OC_6H_4$ -4-O(CH_2) $_8C_6H_5$	Н	Н	Н	н
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (3-OCH ₃)-4-OC ₁₁ H ₂₃	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (3-OCH ₃)-4-OC ₁₁ H ₂₃	COCH3	н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (3-F)-4-O(CH ₂) ₆ CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (3-F)-4-O(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (3-F)-4-O(CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	Н	н	Н

R	R²	R³	R ⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (3-F)-4-O(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
$(CH_2)_2C_6H_3(2-F)-4-O(CH_2)_6CH_3$	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-O(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH₃	Н	COCH3	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-O(CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-O(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH ₃	н	COCH3	COCH ₃
(CH₂)₂C ₆ H₄-4-N(CH₃)C ₇ H₁₅	н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-N(CH ₃)C ₇ H ₁₅	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-N(CH ₃)C ₁₁ H ₂₃	Н	н	н	н
$(CH_2)_2C_6H_4$ -4-N(CH_3) $C_{11}H_{23}$	COCH3	Н	COCH3	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₆ H ₁₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₆ H ₁₃	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₁₀ H ₂₁	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₁₀ H ₂₁	COCH ₃	н	COCH₃	COCH ₃

R	R²	R³	R⁴	R⁵
2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	н	н	. Н	н
CH_2 -2- C_4H_2S -4- $(CH_2)_9CH_3$	COCH3	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ CH ₃	н	н	н	Н
$(CH_2)_2$ -2- C_4H_2S -4- $(CH_2)_8CH_3$	COCH3	н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₃ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	н :	Н	н	н
(CH ₂) ₄ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ CH ₃	н	н	Н	н
(CH ₂) ₄ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH₃	н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₅ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₅ CH ₃	Н	Н	. Н	н
(CH ₂) ₅ -2-C₄H ₂ S-4-(CH ₂) ₅ CH ₃	COCH₃	. н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₆ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₄ CH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₆ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₄ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₇ -2-C₄H ₂ S-4-(CH ₂) ₃ CH ₃	н	Н	н	H
(CH ₂) ₇ ·2-C₄H ₂ S-4-(CH ₂) ₃ CH ₃	COCH ₃	н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₈ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₂ CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₉ -2-C ₄ H ₂ S-4-CH ₂ CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₉ -2-C₄H ₂ S-4-CH ₂ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₀ -2-C₄H ₂ S-4-CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₀ -2-C ₄ H ₂ S-4-CH ₃	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₁₁ -2-C ₄ H ₃ S	Н	н	Н	н
(CH₂) ₁₂ -2-C₄H₃S	н	н	н	н
(CH ₂) ₁₃ -2-C ₄ H ₃ S	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₁₄ -2-C ₄ H ₃ S	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₅ -2-C ₄ H ₃ S	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₅ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	Η .	COCH ₃	COCH3
(CH ₂) ₁₆ -2-C ₄ H ₃ S	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₁-2-C₄H₃S	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₉ -2-C₄H ₃ S	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₁₈ -2-C ₄ H ₃ S	COCH3	н	COCH3	COCH ₃

R	R²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	Н	Н	H	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH3	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH3
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₂ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	COCH₃	Н	COCH3	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-CH ₂ C ₆ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH₃	Н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH3
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	н	Н	Н	. н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	COCH₃	н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	COCH ₃	Н	COCH3	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -2-C ₄ H ₃ S	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₃ S	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -2-C ₄ H ₃ S	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -2-C ₄ H ₃ S	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -2-C ₄ H ₃ S	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -2-C ₄ H ₃ S	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -2-C ₄ H ₃ S	COCH₃	٠н	COCH ₃	COCH
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -2-C ₄ H ₃ S	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -2-C ₄ H ₃ S	Н	Н.	н	Н

121

R	R²	R³	R ⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -2-C ₄ H ₃ S	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -2-C ₄ H ₃ S	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -2-C ₄ H ₃ S	COCH3	Н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -3-C ₄ H ₃ S	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 -4- $(CH_2)_2$ -3- C_4H_3 S	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 -4- $(CH_2)_3$ -3- C_4H_3 S	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -3-C ₄ H ₃ S	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -3-C ₄ H ₃ S	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -3-C ₄ H ₃ S	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -3-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -3-C ₄ H ₃ S	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -3-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -3-C ₄ H ₃ S	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -3-C ₄ H ₃ S	COCH₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -3-C ₄ H ₃ S	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -3-C ₄ H ₃ S	COCH₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₃ S	н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	н	COCH3	COCH ₃
2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	Н	н	Н	н
CH ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	н	H	Н	н
CH ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	COCH₃	н	Н	н
CH ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ CH ₃	Н	н	Н	H
(CH ₂) ₃ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH3	COCH ₃
(CH ₂) ₄ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH₂)₅-2-C₄H₂S-5-(CH₂)₄CH₃	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₅ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	COCH3	Н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₆ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₆ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH3	COCH₃

			· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	
R	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₇ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₂ CH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ -2-C ₄ H ₂ S-5-CH ₂ CH ₃	COCH ₃	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ -2-C ₄ H ₂ S-5-CH ₂ CH ₃	COCH₃	Н	COCH3	COCH3
(CH ₂) ₈ -2-C ₄ H ₂ S-5-CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ -2-C ₄ H ₂ S-5-CH ₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₈ -3-C ₄ H ₃ S	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ -3-C ₄ H ₃ S	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₃ S	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ -3-C ₄ H ₃ S	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₂ -3-C ₄ H ₃ S	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₃ -3-C ₄ H ₃ S	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₄ -3-C ₄ H ₃ S	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₅ -3-C ₄ H ₃ S	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₁₆ -3-C ₄ H ₃ S	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ -3-C ₄ H ₃ S	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₈ -3-C ₄ H ₃ S	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₂ CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₂ CH ₃	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C₄H ₂ S-5-CH ₂ C ₆ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₂-2-C₄H₂S-5-(CH₂)₀C₀H₅	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH
(CH ₂) ₂ -2-C₄H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH

R	R²	R³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	COCH₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ -2- C_4H_2 S-5- $(CH_2)_9C_6H_5$	COCH ₃	Н	COCH3	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C₄H₂S-5-(CH₂) ₁₀ C ₆ H₅	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	COCH3	н	COCH3	COCH ₃
3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	н	н	н	Н
CH_2 -3- C_4H_2S -4-(CH_2) $_{10}CH_3$	н	н	н	н
CH ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH ₃	н	н	Н
CH ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH₃	н	COCH₃	COCH₃
$(CH_2)_2$ -3- C_4H_2S -4- $(CH_2)_9CH_3$	н	н	Н	н
$(CH_2)_2$ -3- C_4H_2 S-4- $(CH_2)_9$ CH ₃	COCH₃	н	н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH₃	н	COCH₃	COCH ₃
$(CH_2)_3$ -3- C_4H_2S -4- $(CH_2)_8CH_3$	н	н	н	н
$(CH_2)_3$ -3- C_4H_2S -4- $(CH_2)_8CH_3$	COCH₃	н	COCH₃	COCH3
(CH ₂) ₄ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₄ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₅ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ CH ₃	н	н	н	н
(CH₂)₅-3-C₄H₂S-4-(CH₂)₅CH₃	COCH ₃	н	COCH3	COCH ₃
(CH ₂) ₆ -3-C₄H ₂ S-4-(CH ₂)₅CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₆ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₅ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₇ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₄ CH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ -3-C₄H ₂ S-4-(CH ₂)₄CH ₃	COCH₃	н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₈ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₃ CH ₃	н	н	Н	н
(CH ₂) ₈ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₃ CH ₃	COCH₃	н	COCH₃	COCH₃
(CH ₂) ₉ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₂ CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₂ S-4-CH ₂ CH ₃	COCH₃	н	Н	н
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₂ S-4-CH ₂ CH ₃	COCH ₃	н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₁ -3-C ₄ H ₂ S-4-CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₁₁ -3-C₄H ₂ S-4-CH ₃	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ CH ₃	н	Н	Н	н
(CH₂)₂-3-C₄H₂S-4-(CH₂) ₉ CH₃	н	Н	н	н
$(CH_2)_2$ -3- C_4H_2S -4- $(CH_2)_9CH_3$	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH3
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	н	Н	Н	Н

	?			55
R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH3
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	Н	н 	Н	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	Н	Н	H	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-CH ₂ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ -3- C_4H_2S -4- $(CH_2)_2C_6H_5$	H	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ -3- C_4H_2S -4- $(CH_2)_4C_6H_5$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ -3- C_4H_2S -4- $(CH_2)_5C_6H_5$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ -3- C_4H_2S -4- $(CH_2)_6C_6H_5$	Н	Н	H	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	·H	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	COCH₃	н	COCH ₃	COCH
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	COCH ₃	н	COCH₃	COCH
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	COCH₃	н	COCH₃	COCH
3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	н	н	н	Н
CH ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	Н	н	Н	Н
CH ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH₃	н	COCH₃	COCH
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	COCH₃	н	COCH ₃	COCH
(CH ₂) ₃ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₄ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH₃	Н	COCH₃	COCH
(CH ₂) ₅ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₅ CH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₅ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₅ CH ₃	COCH₃	Н	COCH ₃	COCH
(CH ₂) ₆ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₆ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	COCH ₃	н	COCH₃	COCH
(CH ₂) ₇ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₇ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH₃	СОСН

R	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₈ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₂ CH ₃	н	Н	Н	н
(CH₂) ₉ -3-C₄H₂S-5-CH₂CH₃	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_9$ -3- C_4H_2 S-5- CH_2CH_3	COCH ₃	Н	COCH3	COCH3
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₂ S-5-CH ₃	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₂ S-5-CH ₃	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH ₃
$(CH_2)_2$ -3- C_4H_2S -5- $(CH_2)_7CH_3$	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	н	н	н	· H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH ₃
$(CH_2)_2$ -3- C_4H_2 S-5- $(CH_2)_{10}CH_3$	н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₂₀ CH ₃	COCH ₃	н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ -3-C₄H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	Н	COCH ₃	COCH₃
(CH ₂) ₂ -3-C₄H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	COCH₃	н	COCH ₃	COCH ₃
$(CH_2)_2$ -3- C_4H_2 S-5- $CH_2C_6H_5$	Н	Н	н	н
$(CH_2)_2$ -3- C_4H_2 S-5- $(CH_2)_2C_6H_5$	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	COCH₃	н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	COCH₃	н	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	COCH₃	Н	COCH₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	COCH₃	н	COCH ₃	COCH ₃

CH₂OR⁴ R²R³N−C−CH₂OR⁵ R

R	R²	R³	R⁴	R⁵
2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	Η.	Н	Н
CH2-2-C5H3N-4-(CH2)9CH3	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₆ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₅ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₄ CH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₇ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₃ CH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₈ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₂ CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₃ N-4-CH ₂ CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₀ -2-C ₅ H ₃ N-4-CH ₃	Н	н	н	H
CH₂-2-C₅H₄N	н	Н	н	Н
CH ₂ -2-C ₅ H ₄ N	CH³CO	н	CH₃CO	CH3CO
(CH ₂) ₁₁ -2-C ₅ H₄N	н	н	н	H
(CH₂) ₁₁ -2-C₅H₄N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH³CO
(CH₂) ₉ -2-C₅H₄N	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₄ N	CH³CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₁₀ -2-C ₅ H ₄ N	Н	Н	. Н	Н
(CH ₂) ₁₀ -2-C ₅ H₄N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH₂)₁₂-2-C₅H₄N	н	Н	Н	н
(CH₂)₁₂-2-C₅H₄N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₁₃ -2-C₅H₄N	Н	Н.	Н	·H
(CH ₂) ₁₃ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₁₄ -2-C ₅ H ₄ N	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₁₅ -2-C ₅ H ₄ N	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₅ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₁₆ -2-C ₅ H ₄ N	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₆ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH₂) ₁₇ -2-C₅H₄N	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₇ -2-C ₅ H ₄ N	CH³CO	Н	CH₃CO	CH3CO

R	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₈ CH ₃	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₂ CH ₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₂ CH ₃	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-CH ₂ -C ₆ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-CH ₂ -C ₆ H ₅	CH₃CO	н	CH ₃ CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅ .	н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH ₃ CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -2-C ₅ H ₄ N	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₄ N	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH3CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -2-C ₅ H ₄ N	Н	. Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -2-C ₅ H ₄ N	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -2-C ₅ H ₄ N	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO

R	₽²	R³	R ⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -2-C ₅ H ₄ N	H	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -2-C ₅ H ₄ N	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -2-C ₅ H ₄ N	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₄ N	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₄ N	CH3CO	Н	CH3CO	CH3CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -2-C ₅ H ₄ N	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -2-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH3CO	CH₃CO
4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	н	Н	Н	н
CH2-4-C5H3N-2-(CH2)9CH3	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₃ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ CH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₆ CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₅ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₅ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₆ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₄ CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₈ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₂ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ -4-C ₅ H ₃ N-2-CH ₂ CH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ -4-C ₅ H ₃ N-2-CH ₃	н	н	Н	н
CH₂-4-C₅H₄N	н	Н	н	Н
CH2-4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH3CC
(CH ₂) ₃₁ -4-C ₅ H ₄ N	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH3CC
(CH ₂) ₉ -4-C ₅ H ₄ N	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₉ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CC
(CH ₂) ₁₀ -4-C ₅ H ₄ N	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₀ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CC
(CH ₂) ₁₂ -4-C ₅ H ₄ N	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₁₂ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Ħ	CH ₃ CO	CH₃CC
(CH ₂) ₁₃ -4-C ₅ H ₄ N	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₃ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH³C(
(CH ₂) ₁₄ -4-C ₅ H ₄ N	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃C(

R	R ²	R³	R⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₅ -4-C ₅ H ₄ N	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{15}$ -4- C_5H_4N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₁₆ -4-C ₅ H ₄ N	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₆ -4-C ₅ H ₄ N	CH3CO	н	CH₃CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₇ -4-C ₅ H ₄ N	Н	н	н	н
(CH ₂) ₁₇ -4-C₅H₄N	CH₃CO	н	CH₃CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ CH ₃	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-CH ₂ -C ₆ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-CH ₂ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	H
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	CH3CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH3CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH3CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	CH3CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -4-C ₅ H ₄ N	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₄ N	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO

R	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -4-C ₅ H ₄ N	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH3CO	CH3CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -4-C ₅ H ₄ N	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH³CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -4-C ₅ H ₄ N	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	н	CH₃CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -4-C ₅ H ₄ N	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -4-C ₅ H ₄ N	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -4-C ₅ H ₄ N	CH3CO	н	CH₃CO	CH3CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -4-C ₅ H ₄ N	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH3CO	CH3CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -4-C ₅ H ₄ N	н	Н	. н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -4-C ₅ H ₄ N	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -4-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH ₃ CO
2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	Н	Н	Н	Н
CH ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	Н	Н	Н	н
CH₂-2-C₅H₃N-5-(CH₂) ₈ CH₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₆ CH ₃	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₄ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₅ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂)₄CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₆ -2-C₅H₃N-5-(CH ₂)₃CH₃	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₇ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₂ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ -2-C ₅ H ₃ N-5-CH ₂ CH ₃	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₃ N-5-CH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	CH3CO	Н	CH3CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-CH ₂ -C ₆ H ₅	Н	Н	Н	H _.
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-CH ₂ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH3CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO

R	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH3CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH3CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH3CO	CH³CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	CH₃CO	H,	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	CH₃CO	н	CH₃CO	CH³CO
5-C ₈ H ₃ N-2-(CH ₂) ₉ CH ₃	Н	н	н	н
CH ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ CH ₃	н	н	н	н
CH ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	н	Н	• н
(CH ₂) ₃ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₆ CH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ -5-C ₅ H ₃ N-25-(CH ₂) ₅ CH ₃	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂)₄CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₆ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ CH ₃	н	н	Н	н
(CH ₂) ₇ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₂ CH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₈ -5-C ₅ H ₃ N-2-CH ₂ CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₉ -5-C ₅ H ₃ N-2-CH ₃	н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ CH ₃	CH₃CO	Н	CH3CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-CH ₂ -C ₆ H ₅	Н	·H	н	Н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-CH ₂ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	CH₃CO	H·	CH₃CO	CH₃CO

PCT/JP93/01515

R	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	CH3CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	CH3CO	Н	CH₃CO	CH3CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	н	Н	н	. Н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH3CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	CH3CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH3CO	CH³CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	CH3CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	Н	Н	н
CH ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₉ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₇ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₄ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₆ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₅ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₅ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₆ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂)₄CH ₃	Н	Н	Н	H
(CH ₂) ₇ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₃ CH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₈ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₂ CH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₃ N-6-CH ₂ CH ₃	Н	Н	. н	Н
(CH ₂) ₁₀ -2-C ₅ H ₃ N-6-CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	Н	H	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₈ CH ₃	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	CH3CO	Н	CH₃CO	CH³CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-CH ₂ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-CH ₂ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH3CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	Н	CH₃CO	CH₃CO

å.

R	R²	R ³	R⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	Н	Н	Н .	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	CH3CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	H	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	CH3CO	Н	CH3CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	CH₃CO	н	CH3CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH³CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	CH3CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	Н	Н	н	н
CH ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₄ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₆ CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₅ CH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₆ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₇ 3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₈ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₂ CH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₉ -3-C ₅ H ₃ N-5-CH ₂ CH ₃	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₅ H ₃ N-5-CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ -3-C ₅ H ₄ N	н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₁ -3-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₉ -3-C ₅ H ₄ N	Н	н	н	н
(CH ₂) ₉ -3-C ₅ H ₄ N	CH³CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₅ H ₄ N	н	н	н	Ĥ
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₅ H ₄ N	CH3CO	н	CH3CO	CH₃CO
(CH ₂) ₁₂ -3-C ₅ H ₄ N	н	Н	н	H
(CH ₂) ₁₂ -3-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₃ -3-C ₅ H ₄ N	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₃ -3-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	н	CH3CO	CH3CO
(CH ₂) ₁₄ -3-C ₅ H ₄ N	н	н	н	н
(CH ₂) ₁₄ -3-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₁₅ -3-C ₅ H ₄ N	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₅ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₁₆ -3-C ₅ H ₄ N	н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₆ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₁₇ -3-C ₅ H ₄ N	н	Н	н	н
(CH ₂) ₁₇ -3-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	CH₃CO	н	CH₃CO	CH3CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	Н	н	н	н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-CH ₂ -C ₆ H ₅	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-CH ₂ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	CH3CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	CH³CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH ₃ CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	CH³CO	Н	CH3CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	CH ₂ CO	Н	CH₃CO	CH₃CO

R	R²	R³	R⁴	. R ⁵
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ -3- C_5H_3N -5- $(CH_2)_g$ - C_gH_5	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
$(CH_2)_2$ -3- C_5H_2 N-5- $(CH_2)_{10}$ - C_6H_5	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	CH₃CO	Н	CH3CO	CH₃CO
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 -4- CH_2 -3- C_5H_4 N	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -3-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH ₃ CO	CH3CO
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 -4- $(CH_2)_2$ -3- C_5H_4 N	Н	Н	н	н
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 -4- $(CH_2)_2$ -3- C_5H_4 N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -3-C ₅ H ₄ N	н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -3-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -3-C ₅ H ₄ N	н	Н	H.	Н
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 -4- $(CH_2)_4$ -3- C_5H_4N	CH ₃ CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 -4- $(CH_2)_5$ -3- C_5H_4N	н	Н	H	н
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 -4- $(CH_2)_5$ -3- C_5H_4 N	CH ₃ CO	Н	CH3CO	CH₃CO
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 -4- $(CH_2)_6$ -3- C_5H_4 N	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 -4- $(CH_2)_6$ -3- C_5H_4N	CH ₃ CO	Н	CH3CO	CH3CO
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 -4- $(CH_2)_7$ -3- C_6H_4N	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	Н	CH3CO	CH³CO
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 -4- $(CH_2)_8$ -3- C_5H_4N	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -3-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -3-C ₅ H ₄ N	Н	Н	н	н
$(CH_2)_2$ - C_6H_4 - $(CH_2)_9$ -3- C_5H_4N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -3-C ₅ H ₄ N	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -3-C ₅ H ₄ N	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO

0		R ³	R⁴ ·	R⁵
R				
———N—(CH₂) ₉ CH₃	Н	Н	н	Н
CH ₂ —CH ₂) ₈ CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ — N- (CH ₂) ₇ CH ₃	н	н	н	Н
$(CH_2)_3 - N - (CH_2)_6 CH_3$	н	н	н	Н .
(CH ₂) ₄	Н	Н	н	н
(CH ₂) ₅ ——N—(CH ₂) ₄ CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₆ ——N—(CH ₂) ₃ CH ₃	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
$(CH_2)_7$ $ (CH_2)_2CH_3$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₈ ——N— CH ₂ CH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₉ ——N—CH ₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ ——NH	Н	Н	Н	н
(CH ₂)11—NH	н	Н	Н	н
CH_2 $-N$ $-(CH_2)_8CH_3$	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -N-(CH ₂) ₇ CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₃ -N (CH ₂) ₆ CH ₃ H	Н	Н	Н	Н

R	R²	R³	R⁴	R⁵
$(CH_2)_4$ $-N$ $-(CH_2)_5CH_3$	н	н	Н .	н
(CH ₂) ₅ -N-(CH ₂) ₄ CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₆ -N (CH ₂) ₃ CH ₃	н	н	Н	н
$(CH_2)_7 - N \longrightarrow (CH_2)_2 CH_3$	Н	н	н	н
(CH ₂) ₈ -N-CH ₂ CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₉ -N—CH ₃	н	н	Н	н ,
(CH ₂) ₁₀ -N	н	н	н	Н
$(CH_2)_2 - N$ $(CH_2)_8 CH_3$	н	н	н	Н
$(CH_2)_2 - N$ $-(CH_2)_9 CH_3$	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ -N-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -N (CH ₂) ₁₁ CH ₃	н	н	Н	Н
$(CH_2)_{11} - N$	н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₂ -N	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₁₃ -N.	н	н	н	н
(CH ₂) ₁₄ -N	н	н	н	Н
(CH ₂) ₁₅ -N	н	Н	н	Н
(CH ³) ¹⁸ -N	н	Н	н	Н
(CH₂)11 — NH	Н	н	н	Н

R	R²	R³	R⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₂ ——NH	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₁₃ ——NH	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₁₄ ——NH	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₅ ——NH	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₆ ——NH	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -CH ₂ -N	н	Н	Н	. Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_2$ $-N$	н	Н	. Н	н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₃ -N	н	Н	Н	н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_4$ $-N$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $(CH_2)_5$	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_6$ $(CH_2)_6$	H	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_7$ $(CH_2)_7$	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₈ -N	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ $(CH_2)_9$	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₁₀ -N	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ ——NH	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₂ NH	Н	.Н	Н	н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₃ —NH	Н	Н	Н	Н

R	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₄ NH	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₅ NH	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₆ NH	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_7$ NH	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₈ —(NH	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ NH	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₁₀ NH	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂	н	н	н	Н
$(CH_2)_2$ $N-(CH_2)_2$	н	Н	н	Н
$(CH_2)_2$ $N-(CH_2)_3$	H	Н	H	Н
$(CH_2)_2$ $N-(CH_2)_4$	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $N-(CH_2)_5$	н	н	н	Н
$(CH_2)_2$ N $(CH_2)_6$ N	н	Н	Н	н
$(CH_2)_2$ $N-(CH_2)_7$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ N $(CH_2)_g$	н	Н	н	Н
$(CH_2)_2$ N $(CH_2)_g$	н	н	Н	н
$(CH_2)_2$ N $(CH_2)_{10}$ $(CH_2)_{10}$	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -N—CH ₂ —	Н	н	н	Н

R	R²	R³	R ⁴	R ⁵
$(CH_2)_2 - N$ $(CH_2)_2$ $(CH_2)_2$	н	н	н .	Н
$(CH_2)_2 - N$ $(CH_2)_3$	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_2 - N - (CH_2)_4 - C$	Н	н	н	Н
$(CH_2)_2 - N - (CH_2)_5 - C$	н	н	н	н
$(CH_2)_2 - N - (CH_2)_6 - C$	Н	н	Н	н
$(CH_2)_2 - N - (CH_2)_7 - C$	Н	Н	н	н
$(CH_2)_2 - N - (CH_2)_8$	Н	н	н	н
$(CH_2)_2 - N - (CH_2)_9$	Н	н	н	н
$(CH_2)_2 - N - (CH_2)_{10}$	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ -N	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ —————————————————————————————————	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ ——NH	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_2$ N - CH_3	н	н	Н	н
$(CH_2)_2$ $N-CH_3$ $(CH_2)_2$ $N-(CH_2)_8$ CH_3	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₉ CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₈ CH ₃ H	н	Н	Н	н
	141		. •	

R	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃ N H	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_8CH_3$	Н	Н	Н	Н
(CH₂)₂N—(CH₂)9CH₃	Н	н	Н	Н
CH ₂ -N-(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -N-(CH ₂) ₇ CH ₃	Н	Н	Н	H
(CH ₂) ₃ -N-(CH ₂) ₆ CH ₃	н	Н	H .	н
(CH ₂) ₄ -N-(CH ₂) ₅ CH ₃	Н	Н	Н	• Н
$(CH_2)_5$ $-N$ N $-(CH_2)_4CH_3$	Н	Н	н .	Н
(CH ₂) ₆ -N-(CH ₂) ₃ CH ₃	Н	Н.	Н	Н
(CH ₂) ₇ -N-(CH ₂) ₂ CH ₃	Н	Н	, Н	Н
(CH ₂) ₈ -N-CH ₂ CH ₃	н	Н	Н	Н

;

R	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₉ -N-CH ₃	Н	Н	н .	н
(CH ₂) ₁₀ - NNH	н	Н	н	Н
$(CH_2)_2 - N N - (CH_2)_2 - N$	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
$(CH_2)_2 - N N - (CH_2)_3 - N$	н	Н	н	н
(CH ₂) ₂ -NN-(CH ₂) ₄	н	Н	н	н
$(CH_2)_2 - N N - (CH_2)_5 - (CH_2)_5$	н	н	Н	Н
$(CH_2)_2 - N N - (CH_2)_6 - N$	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_2 - N N - (CH_2)_7 - (CH_2)_7$	Н	н	H	Н
$(CH_2)_2 - N N - (CH_2)_8 - N$	н	Н	Н	н
$(CH_2)_2 - N N - (CH_2)_9 - N$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2 - N - (CH_2)_{10} - $	н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ ——CH ₂ -N_NH	Н	н	н	н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_2$ $-N$ NH	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₃ —NNH	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_4$ $-N$ NH	н	Н	Н	н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $-N$ NH	н	Н	н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_6$ $-N$ NH	. Н	Н	Н	Н

:

R	R²	R³	R⁴	R⁵
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_7$ NH	Н	Н	н .	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_8$ $ N$ NH	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ — $(CH_2)_9$ — N NH	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_{10}$ $ N$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -N-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	Н	н	н
CH ₂ —(CH ₂) ₉ CH ₃	H,	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ —(CH ₂) ₇ CH ₃	н	н	Н	H
(CH ₂) ₄ —(CH ₂) ₆ CH ₃	н	н	Н	Н
(CH ₂) ₅ —(CH ₂) ₅ CH ₃	н	Н	н	н
(CH ₂) ₆ —(CH ₂) ₄ CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₇ —(CH ₂) ₃ CH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₈ (CH ₂) ₂ CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₉ —CH ₂ CH ₃	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₀ CH ₂ CH ₃	н	н	Н	Н
CH ₂ -N (CH ₂) ₉ CH ₃	Н	H	Н	Н

144

R	R²	R³	R⁴	R ⁵ _
(CH ₂) ₂ -N (CH ₂) ₈ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₃ -N (CH ₂) ₇ CH ₃	н .	Н	Н	Н
$(CH_2)_4 - N \longrightarrow (CH_2)_6 CH_3$	н	н	н	Н
$(CH_2)_5 - N \longrightarrow (CH_2)_5 CH_3$	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₆ -N (CH ₂) ₄ CH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₇ -N (CH ₂) ₃ CH ₃	н .	н	н	Н
(CH ₂) ₈ -N (CH ₂) ₂ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₉ -N CH ₂ CH ₃	н	н .	н	Н
(CH ₂) ₁₀ -N CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -N (CH ₂) ₁₂ CH ₃	н	н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $CH_2 - N$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_2$ N	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_3$ $(CH_2)_3$	Н	Н	н	н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_4$ $(CH_2)_4$	CH³CO	Н	CH₃CO	CH³CO
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $(CH_2)_5$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_6$ $(CH_2)_6$	Н	н	Н	н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₇ —N	Н	Н	н	н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_8$ N	Н	н	Н	Н

R	R²	R ³	R⁴	R⁵
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ N	Н	Н	H ·	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_{10}$ $-N$	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ -N (CH ₂) ₁₂ CH ₃	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₁₂ CH ₃	н	Н	н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_8CH_3$	н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₈ CH ₃ H	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ —[O]_(CH ₂) ₇ CH ₃	н	н	н	н
(CH ₂) ₃ —O (CH ₂) ₆ CH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₄ —(CH ₂) ₅ CH ₃	н	н	Н .	Н
(CH ₂) ₅ —(CH ₂) ₄ CH ₃	н	н	н	Н
(CH ₂) ₆ —O (CH ₂) ₃ CH ₃	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₇ —(CH ₂) ₂ CH ₃	н	Н	н	н
$(CH_2)_7$ O $(CH_2)_2CH_3$ $(CH_2)_8$ O CH_2CH_3 $(CH_2)_9$ O CH_3	Н	н	Н	Н
(CH ₂) ₉ —CH ₃	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO

(CH ₂) ₂ CO (CH ₂) ₁ ,CH ₃ (CH ₂) ₂ CO (CH ₂) ₂ ,CH ₃ (CH ₂) ₂ CO (CH ₂) ₂ (CH ₂) ₂ CO (CH ₂) ₃ (CH ₂) ₃ CO (CH ₂) ₃ (CH ₂	R	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃ CO H CH ₃ CO CH ₃ CO (CH ₂) ₂ CH ₂ CO (CH ₂) ₃ CH H H H H H H CH ₃ CO (CH ₂) ₃ CH ₃ CO (CH ₂) ₃ CH H H H H H H CH ₃ CO (CH ₂) ₃ CH ₃ CO (CH ₂) ₄ CH H H H H H H CH ₃ CO (CH ₂) ₂ CH ₂ CO (CH ₂) ₄ CH H H H H H H CH ₃ CO (CH ₂) ₂ CH ₃ CO (CH ₂) ₅ CH H H H H H H CH ₃ CO (CH ₂) ₅ CH ₃ CO (CH ₂) ₅ CH ₃ CO (CH ₂) ₅ CH H H H H H H CH ₃ CO (CH ₂) ₅ CH ₃ CO (CH ₂) ₅ CH CH ₃ CO (CH ₂) ₅ CH H H H H H H H H H H H H H H H H H H	(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₁₁ CH ₃	н	н	н .	н
$(CH_{2})_{2} = \bigcirc C + (CH_{2})_{2} = \bigcirc C + (CH_{2}$	(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₂ CH ₃	н	н	н	н
$(CH_{2})_{2} = \bigcirc_{C} C(CH_{2})_{3} = \bigcirc_{C}$	(CH ₂) ₂ —O CH ₂ —C	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₄ H H H H (CH ₂) ₂ (CH ₂) ₅ H H H H (CH ₂) ₂ (CH ₂) ₆ H H H H (CH ₂) ₂ (CH ₂) ₇ H H H H (CH ₂) ₂ (CH ₂) ₇ H H H H (CH ₂) ₂ (CH ₂) ₇ C CH ₂ (CH ₂) ₈ H H H H H (CH ₂) ₂ C CH ₂ (CH ₂) ₉ C CH ₂	$(CH_2)_2$ $(CH_2)_2$	н	Н	Н	Н
$(CH_{2})_{2} = \begin{array}{ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	(CH ₂) ₂ —O (CH ₂) ₃ —O	н	н	н	н
$(CH_{2})_{2} - O - (CH_{2})_{6} - O - (CH_{2})_{6} - O - (CH_{2})_{6} - O - (CH_{2})_{6} - O - (CH_{2})_{7} - O - (CH_{2})_{7} - O - (CH_{2})_{7} - O - (CH_{2})_{8} - O - (CH_{2})_{8} - O - (CH_{2})_{8} - O - (CH_{2})_{8} - O - (CH_{2})_{9} - O - (CH_{2})_{9$	(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₄	. Н	н	н	Н
$(CH_{2})_{2} - (CH_{2})_{7} - (CH_{2})_{7} - (CH_{2})_{8} - (CH_{2})_{9} - (CH_$	(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₅	Н	Н	н	Н
$(CH_{2})_{2} - O - (CH_{2})_{8} - H + H + H + H$ $(CH_{2})_{2} - O - (CH_{2})_{9} - CH_{2} - O - (CH_{2})_{10} - CH_{2} - O - (CH_{2})_{10} - CH_{2} - O - (CH_{2})_{2} - O - (CH_{2})$	(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₆	Н	н	н	Н
$(CH_{2})_{2} - O - (CH_{2})_{9} - O - (CH_{2})_{10} - (CH_{2})_{10} - (CH_{2})_{10} - (CH_{2})_{10} - (C$	(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₇	Н	Н	Н	н
$(CH_{2})_{2} - (CH_{2})_{10} - (CH_{2})_{10}$	(CH ₂) ₂ —O (CH ₂) ₈ —O	Н	Н	Н	Н
$(CH_{2})_{2} - CH_{2} - CH_{$	(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₉ —	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_2$ $(CH_2)_3$ $(CH_2)_4$ $(CH_2)_2$ $(CH_2)_4$	(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₁₀	CH₃CO	н	CH₃CO	CH₃CO
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_3$ $(CH_2)_4$ $(CH_2)_2$ $(CH_2)_4$	$(CH_2)_2$ CH_2 CH_2	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_4$	$(CH_2)_2$ $(CH_2)_2$ $(CH_2)_2$	H	Н	Н	Н
	(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₃ —O	н	Н	н	Н
	$(CH_2)_2$ $(CH_2)_4$ $(CH_2)_4$		Н	Н	Н

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₅ —(CH ₂)	CH3CO	н	CH³CO .	CH₃CO
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_6$ $(CH_2)_6$	Н	Н	н	н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_7$ $(CH_2)_7$	н	н	н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_8$ $(CH_2)_8$	н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₉ —(O	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₁₀ —(CH ₂)	CH₃CO	Н	CH₃CO	CH₃CO
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₁₁ —()	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₈ CH ₃	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	Н	Н	н	Н

R	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₁₀	н	н	H ·	Н
(CH ₂) ₁₄ —[7]	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ 7	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₅	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2 - (CH_2)_7 CH_3$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_2 I_0 CH_2)_{11}CH_3$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₉ CH ₃	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₁₃ CH ₃	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2 - (CH_2)_8 CH_3$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2 - (CH_2)_{12}CH_3$	Н	Н	Н	. н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_8$ CH_3	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_{12}CH_3$	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_4$ I	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $(CH_2)_5$	Н	Н	Н	H
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_8$ $(CH_2)_8$	Н	Н	Н	Н

149

R	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₉ (CH ₂)	H°	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₄ —	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2 I_0 (CH_2)_8 I_0$	Н	Н	. Н	Н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₆ (CH ₂)	Н	H _.	Н	Н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₁₀	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$	Н	H	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$	Н	H	Н	Н
$(CH_2)_{10}$	Ac	Н	Н	Н
$(CH_2)_{10}$	Ac	Н	Ac	Ac
$(CH_2)_{11}$	Ac	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ (O)	Ac	Н	Ac	Ac
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_7$ CH_3	Ac	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_7$ CH_3	Ac	Н	Ac	Ac

R	R²	R³	R ⁴	R⁵
(CH ₂) ₁₀ —(N)	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₀ —(N)	Ac	Н	Н	Н
$(CH_2)_{10}$ $\stackrel{\longleftarrow}{\longrightarrow}$ $\stackrel{\longleftarrow}{\longrightarrow}$	Ac	Н	Ac	Ac
$(CH_2)_{14}$ $\stackrel{\longleftarrow}{\longrightarrow}$ $\stackrel{\longleftarrow}{\longrightarrow}$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁ , (N)	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁	Ac	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁ , (I) N	Ac	Н	Ac	Ac
(CH ₂) ₁₅	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{11}-N$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{11}-N$	Ac	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₄ -N	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₆	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₆	Ac	Н	Н	Н

÷

R	R²	R ³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₁₀	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ —(I) N H	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₄ —	Ac	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —(N)—(CH ₂) ₈ —()	Н	Н	н	H
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₅	Н	Н	Н	H
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₅	Ac	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₉	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ - (CH ₂) ₅ -	н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ — (CH ₂) ₅ —	Ac	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ — (CH ₂) ₉ —	Н	н	н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₅ —(D	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —[N—(CH ₂) ₅ —[Ac	Н	Н	Н

R	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₉ —()	Ή	Н	Н	. Н
(CH ₂) ₂ -N (CH ₂) ₅ -	Н	Н	Н	н
(CH ₂) ₂ -N (CH ₂) ₉ -	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_6$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2 - N - (CH_2)_{10} - N$	Н	Н	H	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_6$	Ac	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₅ —(N)	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$	Ac	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_4$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₄ —(N)	Ac	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_\theta$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $-(CH_2)_5$ $-N$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $-N$	Ac	Н	Н	Н

R	R²	R³	R⁴	R⁵
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ $-N$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ -N-N	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{15} - N$	Н	Н	H	Η .
(CH ₂) ₁₁ —(1)	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₁₅ —(N)	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_{11} - \langle N \rangle$	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_{15}$ N_N	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $-N_2$ N_3	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ $-N_2$ N_3	Н	Н	Н.	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $(CH_2)_5$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ $(CH_2)_9$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $(CH_2)_5$	Н	н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ $(CH_2)_9$			H	
$(CH_2)_2 - N^{-N}_2 (CH_2)_5 - (CH_2)_5$	H	H	Н	Н
$(CH_2)_2 - N CH_2)_9 - C$	Н	Н	Н	Н

R	R²	R³	R ⁴ -	R⁵
(CH ₂) ₂ —(1) (CH ₂) ₅ —(7)	Н	Н	Н	. н
(CH ₂) ₂ —(N) (CH ₂) ₉ —()	н	н	Н	н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $(CH_2)_5$	Ac	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ -N (CH ₂) ₅ -	Ac	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$	Ac	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $-N_5$ N_5	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ $-N_2$ N_3	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $(CH_2)_5$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ $(CH_2)_9$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ N_N	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ $(CH_2)_9$	Н	Н	Ĥ	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $(CH_2)_5$	Ac	H	Н	Н
(CH ₂) ₁₁ —('S)	Н	Н	Н	Н

R	R²	R³	R⁴	R⁵
(CH ₂) ₁₅ —(S)	Н	Н	Н .	Н
(CH ₂) ₁₁ —(S)	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₁₅ —(S)	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $(CH_2)_5$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ $(CH_2)_9$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$ $(CH_2)_5$	Н	Н	н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ $(CH_2)_9$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —('S)—(CH ₂) ₅ —(S)	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₉ —(CH ₂)	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —('S) (CH ₂) ₅ —(CH ₂)	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —('S) (CH ₂) ₉ —(-)	Н	Н	н	Н
(CH ₂) ₂ —(S) (CH ₂) ₅ —(CH ₂)	Ac	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_5$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —(S)—(CH ₂) ₅ —(CH ₂)	Ac	Н	Н	H

R	R²	R ³	R⁴	R⁵
$(CH_2)_2$ N $(CH_2)_5$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ N $(CH_2)_9$ N	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ N $(CH_2)_5$	Ac	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ N $CH_2)_9$	Ac	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_9$ CH_3	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2 \frac{1}{N_S} (CH_2)_{13} CH_3$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_8$ CH_3	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2 \frac{1}{N_S} (CH_2)_{12} CH_3$	Н	Ĥ	Н	Н
$(CH_2)_2 \frac{1}{N_0} (CH_2)_9 CH_3$	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₁₃ CH ₃	Н	Н	Н	H
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_8$ CH_3	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_{12}$ CH_3	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ N_0 $(CH_2)_8$ CH_3	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_{12}CH_3$	Н	Н	Н	H
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_7$ CH_3	н	Н	Н	H.
$(CH_2)_2 = (I_2)_{11}CH_3$	H	Н	Н	Н

R	R²	R ³	R ⁴	R⁵
$(CH_2)_2$ — $(CH_2)_7$ CH ₃	Н	Н	Н	. Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_{11}CH_3$	H	Н	·H	Н
$(CH_2)_2$ \sim $(CH_2)_6CH_3$	Н	Н	Н	н
$(CH_2)_2$ N $CH_2)_{10}$ CH_3	Н	Н	Н	Н
(CH ₂) ₂ —(CH ₂) ₆ CH ₃	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_{10}$ CH_3	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_7$ CH_3	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2 - (CH_2)_{11}CH_3$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ \longrightarrow $(CH_2)_7$ CH_3	Η.	Н	Н	Н
$(CH_2)_2$ $(CH_2)_{11}CH_3$	н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2 - (CH_2)_6 CH_3$	Н	Н	Н	Н
$(CH_2)_2 - (CH_2)_{10}CH_3$	Н	Н	Н	Н

一般式(I)の化合物(以下、化合物(I)という)の製薬上許容される塩としては、塩酸塩、臭化水素酸塩、硫酸塩等の無機酸との塩、または酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、安息香酸塩、クエン酸塩、リンゴ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩等の有機酸との塩、あるいはカルボキシル基を含む場合は、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、アルミニウム塩等の金属塩、トリエチルアミン等のアミンとの塩またはリジン等の二塩基性アミノ酸との塩があげられる。また、本発明化合物は水和物、溶媒和物等も包含される。

本発明化合物に幾何異性体が存在する場合、本発明はシス体、トランス体さらにはそれらの混合物をも包含するものである。さらに、本発明化合物にその分子内に1個またはそれ以上の不斉中心が存在する場合、それにより各種の光学異性体が存在する。本発明は光学異性体、ラセミ体さらにはジアステレオ異性体、およびそれらの混合物をも包含するものである。

・ 本発明化合物は以下の方法により製造することができる。 (A法)

一般式(II)

$$R'CH_2-G$$
 (II)

〔式中、R¹ CH₂ はRに包含される前記のR¹ CH₂, R¹aCH₂, R¹bCH₂, Ra, Rb, Rc, Rd, Re, Rf, Rg, Rh, Ri, Rj, Rk, Rl, Rm, Rn またはRo と同義である。Gは有機合成化学の分野で広く用いられる脱離基、例えばハロゲン(フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、メタンスルホニルオキシ、p-hルエンスルホニルオキシ、hリフルオロメタンスルホニルオキシを示す。)で表される化合物〔以下、化合物(II)という〕、またはR1 が官能基(アミノ、水酸基、メルカプト、ケトン、カルボキシ等)を有する場合にはそれらを必要に応じて保護した化合物〔以下、化合物B-(II)という〕に、一般式(III)

(式中、Yは低級アルキル(メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、第3級ブチル等)またはアラルキル(ベンジル、ニトロベンジル、メトキシベンジル、メチルベンジル等)を示し、Qは有機合成化学の分野で広く用いられるアミノの保護基、例えばアセチル、ベンゾイル、第3級ブトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニルを示す。さらに式中、分子内の2つのYは同一となってジオキサン等の環を形成してもよい。また、分子内のQとYは同一となってオキサブリジンやオキサジン等の環を形成してもよい。〕で表される化合物(以下、化合物(III)という〕を塩基の存在下縮合し、一般式(IV)

:

(式中、R'、Q、Yは前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(IV)という)とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより、一般式(I-29)

$$CH_2OH$$
 $H_2N-C-CH_2OH$
 CH_2R^I
(I-29)

(式中、 R^+ は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(I-29)という〕またはそのN-および/またはO-保護体を製造することができる

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔54.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(IV)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常 - 20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

カルボキシの還元反応の反応時間は、通常30分間から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物を精製することができる。

(B法)

化合物(II)または化合物B-(II)に、一般式(V)

(式中、Y、Qは前記と同義である。Zは有機合成化学の分野で広く用いられる

·水酸基の保護基、例えばアセチル、ベンゾイル、ベンジル、トリメチルシリル、第3級ブチルジメチルシリル、メトキシメチル、メトキシエトキシメチル、テトラヒドロピラニルを示す。)で表される化合物(以下、化合物(V)という)を塩基の存在下縮合し、一般式(VI)

(式中、 R^1 、Q、Y、Zは前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(VI)という)とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより化合物(I-29)またはそのN-および/またはO-保護体を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ(5.4.0)ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去し

た後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(VI)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナト リウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬 、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常 - 20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

カルボキシの還元反応の反応時間は、通常30分間から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物を精製することができる。

(C法)

化合物(II) または化合物B-(II)に、一般式(VII)

(式中、Yは前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(VII)という)を塩基の存在下縮合し、一般式(VIII)

$$N_3$$
-C-COOY (VIII)

:

(式中、R'、Yは前記と同義である。)で表される化合物 (以下、化合物 (VI II) という) とした後、カルボキシおよびアジドを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより化合物 (I-29) またはそのO-保護体を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(VIII)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナト

リウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬 、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常 - 20 ~ 80 ℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

アジドの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属(パラジウムー炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等)を用いた接触還元があげられる。

アジドの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

アジドの還元反応の反応温度は、通常-20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物を精製することができる。

(D法)

化合物(II)または化合物B-(II)に、一般式(IX)

$$CH2OZ1$$

$$O2N-C-CH2OZ2$$
(IX)

(式中、 Z^1 、 Z^2 は同一または異なって有機合成化学の分野で広く用いられる 水酸基の保護基、例えばアセチル、ベンゾイル、ベンジル、トリメチルシリル、第 3 級プチルジメチルシリル、メトキシメチル、メトキシエトキシメチル、テトラヒドロピラニルを示す。さらに Z^1 、 Z^2 は同一となってジオキサン等の環を 形成していてもよい。)で表される化合物〔以下、化合物(IX)という〕を塩基の存在下縮合し、一般式(X)

$$\begin{array}{c} CH_2OZ^1\\ O_2N-C-CH_2OZ^2\\ CH_2R^I \end{array} \hspace{1cm} (X)$$

(式中、 R^1 、 Z^1 、 Z^2 は前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(X)という)とした後、ニトロを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより化合物(I-29)またはそのO-保護体を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、プチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第 3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン

ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

÷

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (X)を精製することができる。

ニトロの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属(パラジウムー炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等)を用いた接触還元、金属(鉄、亜鉛、スズ等)による還元があげられる。

ニトロの還元反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

ニトロの還元反応の反応温度は、通常 - 20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物を精製することができる。

上記A法~D法は、一般式(I-1)~(I-18)の化合物の合成に適用することができる。

(E法)

一般式(XI)

:

$$(R^{11})_{n} - M \qquad (XI)$$

【式中、R''はR中、前記のCH₂ R', CH₂ R'a, CH₂ R'b, Ra, Rb, Rc, Rd, Re, Rf, Rg, Rh, Ri, Rj, Rk, Rl, Rm, Rn, Ro, Rp, Rq, CH=CHRt, CH=CHRu, (CH₂) α -X-(CH₂) β Rv (ただし、 α \geq 1 の場合)またはCH₂ ORw と同義である。Mは有機合成化学の分野で広く用いられる金属、例えばリチウム、マグネシウムクロリド、マグネシウムプロミド、マグネシウムヨード、銅、リチウム銅、ニッケルを示し、nは1~3の整数を示す。)で表される化合物〔以下、化合物(XI)という〕、またはR''が官能基(アミノ、水酸基、メルカプト、ケトン、カルボキシ等)を有する場合にはそれらを必要に応じて保護した化合物〔以下、化合物B-(XI)という〕を、一般式(XII)

$$\begin{array}{c} COOA \end{array} \tag{XII}$$

(式中、Yは前記と同義である。Q'は有機合成化学の分野で広く用いられるイミノの保護基、例えばアセチル、ベンゾイル、第3級プトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニルを示す。)で表される化合物(以下、化合物(XII)という)に求核付加させ、一般式(IV-a)

$$\begin{array}{c} \text{COOY} \\ \text{Q' HN-C-COOY} \end{array} \qquad \text{(IV-a)}$$

(式中、R''、Q'、Yは前記と同義である。)で表される化合物(IV-a)とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより一般式(I-30)

CH₂OH

$$H_2N-C-CH_2OH$$
 (I-30)

(式中、R ''は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(I-30)という〕またはそのN-および/またはO-保護体を製造することができる

付加反応に用いられる有機溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、ジェチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

付加反応の反応温度は、通常-100~80℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

付加反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により付加反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(IV-a)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常-20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

カルボキシの還元反応の反応時間は、通常30分間から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物を精製することができる。

本方法は、一般式(I-1)~(I-20)、(I-24)、(I-25)、 (I-26)(ただし、 $\alpha \ge 1$ の場合)、(I-27)の化合物の合成に適用することができる。

(F法)

一般式(XIII)

$$CH_2OZ^1$$
 $Q^1Q^2N-C-CH_2OZ^2$ (XIV)

(式中、Q¹、Q²は有機合成化学の分野で広く用いられるアミノの保護基、例

·えばアセチル、ベンゾイル、第3級プトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、ベンジルを示し、どちらか一方は水素であってもよい。 Z¹、 Z² は前記と同義である。)で表される化合物 (以下、化合物 (XIV)という) と塩基の存在下縮合させ、一般式 (XV)

:

$$CH_2OZ^1$$
 CH_2OZ^1 $Q^1Q^2N-\dot{C}-CH_2OZ^2$ または $Q^1Q^2N-\dot{C}-CH_2OZ^2$ $\dot{C}H=CHRt$ $\dot{C}H=CHRu$ $(XV-1)$ $(XV-2)$

(式中、Rt、Ru、Q¹、Q²、Z¹、Z² は前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XV-1)または化合物(XV-2)という〕とした後、さらに必要に応じて保護基を除去することにより化合物(I-24)または(I-25)を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級プトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、プチルリチウム、リチウムへキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じ

てこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XV-1)または化合物(XV-2)を精製することができる。

このように本方法は、一般式(I-24)または(I-25)の化合物の合成に適用することができる。さらに、一般式(I-24)または(I-25)の化合物またはそのN-および/またはO-保護体の二重結合を還元することにより一般式(I-1)~(I-18)、(I-26)(ただし、 $\alpha \ge 2$ の場合)の化合物の合成に適用することもできる。

二重結合の還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属(パラジウムー炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等)を用いた接触還元があげられる。

二重結合の還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタ ノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジ オキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメ チルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

二重結合の還元反応の反応温度は、通常-20~80℃であり、必要に応じて これ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物〔一般式(I-1) \sim (I-18)、(I-26)(ただし、 $\alpha \geq 2$ の場合)の化合物〕を精製することができる。

(G法)

一般式 (XVI)

 R^{III} CH_2G 、 $RpCH_2G$ または $RqCH_2G$ (XVI-1) (XVI-2) (XVI-3)

(式中、R''' はR中、前記のCH₂ R', CH₂ R'a, CH₂ R'b, Ra, Rb, Rc, Rd, Re, Rf, Rg, Rh, Ri, Rj, Rk, Rl, Rm, Rn, Roを示し、Rp、Rq、Gは前記と同義である。)で表される化合物 (以下、化合物 (XVI-1)、化合物 (XVI-2)または化合物 (XVI-3)という)、またはR'' 、Rp、Rqが官能基 (アミノ、水酸基、メルカプト、ケトン、カルボキシ等)を有する場合にはそれらを必要に応じて保護した化合物 (以下、化合物Bー (XVI-1)、化合物Bー (XVI-2)または化合物Bー (XVI-3)という)を、一般式 (XVII)

 $M^{n+}(NO_2^-)_n$ (XVII)

(式中、Mは金属、例えばナトリウム、カリウム、マグネシウム、銀、カルシウム、リチウムを示し、nは1または2の整数を示す。)で表される化合物(以下、化合物(XVII)という)を作用させることにより、一般式(XVIII)

 R^{III} CH_2NO_2 、 $RpCH_2NO_2$ または $RqCH_2NO_2$ (XVIII-1) (XVIII-2) (XVIII-3)

(式中、R'''、Rp、Rq は前記と同義である。)で表される化合物 (以下、化合物 (XVIII-1)、化合物 (XVIII-2)または化合物 (XVIII-3)という〕とした後、これを塩基の存在下ホルマリンと縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、一般式 (XIX)

$$CH_2OZ^1$$
 CH_2OZ^1 CH_2OZ^1 CH_2OZ^1 $O_2N-C-CH_2OZ^2$ または $O_2N-C-CH_2OZ^2$ または $O_2N-C-CH_2OZ^2$ Rq (XIX-1) (XIX-2) (XIX-3)

(式中、 R^{111} 、Rp、Rq、 Z^1 、 Z^2 は前記と同義である。)で表される化合物(IIX-1)、化合物(IIX-2)または化合物(IIX-3)という〕とした後、ニトロを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより、化合物(I-19)、(I-20)を含む目的物を製造することができる。

亜硝酸塩 (XVII) と化合物 (XVI-1)、化合物 (XVI-2)または化合物 (XVI-3)と の縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3 級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XVIII-1)、化合物(XVIII-2)または化合物(XVIII-3)を精製することができる。

化合物 (XVIII-1)、化合物 (XVIII-2)または化合物 (XVIII-3)とホルマリンと の縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3 級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ

・コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XIX-1)、化合物 (XIX-2)または化合物 (XIX-3)を精製することができる。

ニトロの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属(パラジウムー炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等)を用いた接触還元、金属(鉄、亜鉛、スズ等)による還元があげられる。

ニトロの還元反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

ニトロの還元反応の反応温度は、通常 - 20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物を精製することがで

.きる。

本方法は化合物(I-19)および(I-20)の合成に適しているが、一般式 (I-1) \sim (I-18) の化合物の合成にも適用することができる。 (H法)

一般式 (XX)

R
1
CHO 、RrCHO または RsCHO (XX-1) (XX-2) (XX-3)

(式中、 R^1 、Rr、Rs は前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XX-1)、化合物(XX-2)または化合物(XX-3)という)と化合物(IX)を塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護し、一般式(XXI)

$$CH_2OZ^1$$
 CH_2OZ^1 CH_2OZ^1 $O_2N-C-CH_2OZ^2$ $O_2N-C-CH_2OZ^2$ $\sharp \, t \sharp \ O_2N-C-CH_2OZ^2$ $CH(OZa)R^1$ $CH(OZa)Rr$ $CH(OZa)Rs$
(XXI-1)
(XXI-2)
(XXI-3)

(式中、 R^1 、Rr、Rs、 Z^1 、 Z^2 は前記と同義であり、Za は水素または有機合成化学の分野で広く用いられる水酸基の保護基、例えばアセチル、ベングイル、ベンジル、トリメチルシリル、第 3 級プチルジメチルシリル、メトキシメチル、メトキシエトエキシメチル、テトラヒドロピラニルを示す。)で表される化合物(以下、化合物(XXI-1)、化合物(XXI-2)または化合物(XXI-3)という)とした後、ニトロを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより、一般式(XXII)

CH₂OH CH₂OH CH₂OH CH₂OH CH₂OH
$$+$$
2N-C-CH₂OH $+$ 2N-C-CH₂OH $+$ 2N-C-CH₂OH $+$ 2N-C-CH₂OH $+$ 2N-C-CH₂OH CH(OH)Rr CH(OH)Rs (XXII-1) (I-22) (I-23)

-

(式中、 R^1 、Rr、Rs は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXII-1)、化合物(I-22)または化合物(I-23)という〕を製造することができる。

アルデヒドとの縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXI-1)、化合物(XXI-2)または化合物(XXI-3)を精製することができる。

ニトロの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウ

ム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷 移金属(パラジウム-炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム 等)を用いた接触還元、金属(鉄、亜鉛、スズ等)による還元があげられる。

ニトロの還元反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

ニトロの還元反応の反応温度は、通常 - 20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXII-1)、化合物(I-22)または化合物(I-23)を精製することができる。

このように本方法は、一般式(I-21)~(I-23)の化合物の合成に適用することができる。

(I 法) 化合物 (XVIII-1)は次の方法でも製造することができる。

一般式(XX')

 $R^{\prime}CHO$ (XX')

(式中、R^{*} はR^{*} における炭素数が1個少ない置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖を示す。)で表される化合物(以下、化合物(XX))という]とニトロメタンを塩基の存在下縮合して、一般式(XXIII)

 $R^{\prime}CH=CHNO_{2}$ (XXIII)

(式中、R^A は前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XXIII) という)とした後、二重結合を適当な還元剤で還元することにより化合物(XVII

. I-1)を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXIII)を精製することができる。

二重結合の還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属(パラジウムー炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等)を用いた接触還元があげられる。

二重結合の還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタ ノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジ オキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメ チルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

二重結合の還元反応の反応温度は、通常 - 20~80℃であり、必要に応じて これ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

. 上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XVIII-1)を精製することができる。

(J法) 化合物 (XXI-1)、化合物 (XXI-2)または化合物 (XXI-3)は次の方法でも 製造することができる。

ニトロメタンと化合物(XX-1)、化合物(XX-2)または化合物(XX-3)を塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、一般式(XX IV)

(式中、 R^1 、Rr、Rs、Za は前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XXIV-1)、化合物(XXIV-2)または化合物(XXIV-3)という〕とした後、ホルマリンと塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、化合物(XXI-1)、化合物(XXI-2)または化合物(XXI-3)を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上

、またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXIV-1)、化合物(XXIV-2)または化合物(XXIV-3)を精製することができる。

ホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、 エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル 、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスル ホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロ ホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ(5.4.0)ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXI-1)、化合物 (XXI-2)または化合物 (XXI-3)を精製することができる。

(K法) 化合物 (XXI-1)、化合物 (XXI-2)または化合物 (XXI-3)は次の方法でも 製造することができる。

化合物 (XXV)

 $ZOCH_2CH_2NO_2$ (XXV)

11

(式中、乙は前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XXV)という)と化合物(XX-1)、化合物(XX-2)または化合物(XX-3)を塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、一般式(XXVI)

$$CH_2OZ$$
 CH_2OZ CH_2OZ

(式中、R¹、Rr、Rs、Z、Za は前記と同義である。)で表される化合物 [以下、化合物 (XXVI-1)、化合物 (XXVI-2) または化合物 (XXVI-3) という〕 とした後、ホルマリンと塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護 することにより、化合物 (XXI-1)、化合物 (XXI-2)または化合物 (XXI-3)を製造 することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じ

· てこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXVI-1)、化合物(XXVI-2)または化合物(XXVI-3)を精製することができる。

ホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、 エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル 、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスル ホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロ ホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXI-1)、化合物(XXI-2)または化合物(XXI-3)を精製することができる。

(L法) 一般式 (XXVII)

 WCH_2COOY (XXVII)

(式中、Wはアジド、ニトロあるいは適当な保護基で保護されたアミノを示し、 Yは前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XXVII)という)と

一般式(XXVIII)

(式中、R'、Rr、Rs、Halは前記と同義である。)で表される化合物 (以下、化合物 (XXVIII-1)、化合物 (XXVIII-2) または化合物 (XXVIII-3) という) を塩基の存在下縮合し、一般式 (XXIX)

(式中、 R^1 、Rr、Rs、W、Yは前記と同義である。)で表される化合物(VXIX-1)、化合物(VXIX-1)、化合物(VXIX-1)または化合物(VXIX-1)という)とした後、ホルマリンと塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより一般式(VXX)

(式中、 R^1 、Rr、Rs、W、Y、Zは前記と同義である。)で表される化合物(IVT、化合物(IVXX-1)、化合物(IVXX-2)または化合物(IVXX-3)という)とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、一般式(IVXXI)

$$CH_2OZ^1$$
 CH_2OZ^1
 CH_2OZ^1
 $V-C-CH_2OZ^2$
 $V-C-CH_2OZ^2$
 $V-C-CH_2OZ^2$
 $C-R^1$
 O^{-C-Rr}
 O^{-C-Rs}
 $C-R^1$
 O^{-C-Rs}
 O^{-C-Rs}
 $C-R^1$
 $C-R^1$

(式中、 R^1 、Rr、Rs、W、 Z^1 、 Z^2 は前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XXXI-1)、化合物(XXXI-2)または化合物(XXXI-3)という)とした後、カルボニルを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて還元、脱保護することにより化合物(XXII-1)、化合物(I-22)または化合物(I-23)を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXIX-1)、化合物(XXIX-2)または化合物(XXIX-3)を精製することができる。

 ホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、 エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル 、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスル ホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロ ホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXX-1)、化合物(XXX-2)または化合物(XXX-3)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常-20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

カルボキシの還元反応の反応時間は、通常30分間から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去し

た後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXI-1)、化合物(XXXI-2)または化合物(XXXI-3)を精製することができる。

カルボニルの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボニルの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボニルの還元反応の反応温度は、通常-20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

カルボニルの還元反応の反応時間は、通常30分間から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

さらに(i)W=アジドを有する場合、アジドの還元反応に用いられる還元剤 としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アル ミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属(パラジウムー炭素、酸化白金、 ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等)を用いた接触還元があげられる。

アジドの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

アジドの還元反応の反応温度は、通常-20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

(ii) W=ニトロを有する場合、ニトロの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属(パラジウム-炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等)を用いた接触還元、金属(鉄、亜鉛、スズ等)による還元があげられる。

・ ニトロの還元反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

ニトロの還元反応の反応温度は、通常-20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXII-1)、化合物 (I-22) または化合物 (I-23) を精製することができる。

このように本方法は、一般式(I-21)~(I-23)の化合物の合成に適用することができる。

(M法) 化合物 (XXX-1)、化合物 (XXX-2)または化合物 (XXX-3)は次の方法でも 製造することができる。

化合物 (XXVIII) と一般式 (XXXII)

(式中、W、Y、Zは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXXII)という〕を塩基の存在下縮合することにより、化合物(XXX-1)、化合物(XXX-2)または化合物(XXX-3)を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXX-1)、化合物(XXX-2)または化合物(XXX-3)を精製することができる。

(N法) W=ニトロの場合、化合物 (XXXI-1)、化合物 (XXXI-2) または化合物 (XXXI-3) は次の方法でも製造することができる。

化合物 (XXVIII-1)、化合物 (XXVIII-2) または化合物 (XXVIII-3) と化合物 (XXXIII)

١

 CH_3NO_2 (XXXIII)

で表される化合物 (以下、化合物 (XXXIII) という) を塩基の存在下縮合し、一般式 (XXXIV)

(式中、R'、Rr、Rs は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化

合物 (XXXIV-1)、化合物 (XXXIV-2)または化合物 (XXXIV-3)という〕とした後、ホルマリンと塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより化合物 (XXXI-1)、化合物 (XXXI-2) または化合物 (XXXI-3) を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXIV-1)、化合物(XXXIV-2)または化合物(XXXIV-3)を精製することができる。

ホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、 エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル 、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスル ホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロ ホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメ トキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエ

チルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8 - ジアザビシクロ (5.4.0) ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXI-1)、化合物(XXXI-2)または化合物(XXXI-3)を精製することができる。

(O法) 化合物 (XXXIV-1)、化合物 (XXXIV-2)または化合物 (XXXIV-3)は次の方法でも製造することができる。

化合物 (XVII) と一般式 (XXXV)

(式中、R¹、Rr、Rs、Gは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXXV-1)、化合物(XXXV-2)または化合物(XXXV-3)という〕を塩基の存在下縮合することにより、化合物(XXXIV-1)、化合物(XXXIV-2)または化合物(XXXIV-3)を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

. 縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上でまたはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXIV-1)、化合物(XXXIV-2)または化合物(XXXIV-3)を精製することができる。

(P法) W=ニトロの場合、化合物 (XXXI-1)、化合物 (XXXI-2) または化合物 (XXXI-3) は次の方法でも製造することができる。

化合物 (XXV)と化合物 (XXVIII-1)、化合物 (XXVIII-2) または化合物 (XXVIII-3) を塩基の存在下縮合することにより、一般式 (XXXVI)

CH₂OZ CH₂OZ CH₂OZ CH₂OZ
$$O_2N-C-H$$
 O_2N-C-H または O_2N-C-H O_2C-R O_2

(式中、 R^1 、Rr、Rs、Zは前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XXXVI-1)、化合物(XXXVI-2)または化合物(XXXVI-3)という)とした後、ホルマリンと塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、化合物(XXXI-1)、化合物(XXXI-2)または化合物(XXXI-3)を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第

- 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXVI-1)、化合物(XXXVI-2)または化合物(XXXVI-3)を精製することができる。

ホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、 エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル 、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスル ホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロ ホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じ

てこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXI-1)、化合物(XXXI-2)または化合物(XXXI-3)を精製することができる。

(Q法) 化合物 (X)は次の方法でも製造することができる。

化合物(II)と化合物(XXVII)(W=ニトロの場合)を塩基の存在下縮合することにより、一般式(XXXVII)

$$O_2N-\overset{\mathsf{H}}{\overset{\mathsf{C}}{\mathsf{C}}}-\mathsf{COOY} \qquad (XXXVII)$$

(式中、R'、Yは前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XX XVII)という)とした後、ホルマリンと塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、一般式(XXXVIII)

$$CH_2OZ$$
 $O_2N-C-COOY$ (XXXVIII)
 CH_2R^I

(式中、R¹、Y、Zは前記と同義である。)で表される化合物 (以下、化合物 (XXXVIII)という) とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要 に応じて水酸基を保護することにより、化合物 (X)を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ

ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ(5.4.0)ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXVII)を精製することができる。

ホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、 エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル 、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスル ホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロ ホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロ

マトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXXVIII)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常 - 20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

カルボキシの還元反応の反応時間は、通常30分間から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(X)を精製することができる。

(R法)一般式(XXXIX)

$$CH_2OZ^1$$
 CH_2OZ^1 CH_2OZ^1 $Q^1Q^2N-C-CH_2OZ^2$ または $Q^1Q^2N-C-CH_2OZ^2$ CH_2OZ^2 CH_2OZ

(式中、Q¹、Q²、Z¹、Z²、G、 α は前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XXXIX-1)または化合物(XXXIX-2)という〕と一般式(XXXXX)

$$Rv(CH_2)_{\beta}$$
-XH または Rw-OH (XXXX-1) (XXXX-2)

(式中、Rv、Rw、X、 β は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXXX-1)または化合物(XXXX-2)という〕を塩基の存在下縮合させ、一般式(XXXXI)

$$CH_2OZ^1$$
 CH_2OZ^1 $Q^1Q^2N - C - CH_2OZ^2$ $\sharp \not\sim l$ $Q^1Q^2N - C - CH_2OZ^2$ $(CH_2)_{\alpha} - X - (CH_2)_{\beta}$ Rv CH_2ORw $(XXXXI-1)$ $(XXXXI-2)$

(式中、Rv、Rw、X、Q 1 、Q 2 、Z 1 、Z 2 、 α 、 β は前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XXXXI-1)または化合物(XXXXI-2)という)とした後、必要に応じて保護基を除去することにより化合物(I-26)または(I-27)を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、プチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上

またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXXI-1)または化合物(XXXXI-2)を精製することができる。

本反応において、X=スルフィニルまたはスルホニルの化合物は、X=硫黄の化合物を酸化することにより得られる。

このように本方法は、一般式(I-26)または(I-27)の化合物の合成に適用することができる。また、化合物(I-1)、(I-2)、(I-4)、(I-5)、(I-7)~(I-11)の合成にも適用することができる。

(S法) 化合物 (XXXXI-1)または化合物 (XXXXI-2)は次の方法でも製造することができる。

一般式 (XXXXII)

$$CH_2OZ^1$$
 CH_2OZ^1 CH_2OZ^1 CH_2OZ^1 CH_2OZ^2 または CH_2OZ^2 CH_2OZ^2 CH_2OH CH_2OH CH_2OH

(式中、 Q^1 、 Q^2 、 Z^1 、 Z^2 、X、 α は前記と同義である。)で表される化合物(XXXXII-1)または化合物(XXXXII-2)という〕と一般式(XXXXIII)

$$Rv(CH_2)_{\beta}$$
-G または Rw-G (XXXXIII-1) (XXXXIII-2)

(式中、Rv、Rw、G、 β は前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XXXXIII-1)または化合物(XXXXIII-2)という〕を塩基の存在下縮合させ、さらに必要に応じて保護基を除去することにより、化合物(XXXXI-1)または化合物(XXXXI-2)を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXXI-1)または化合物(XXXXI-2)を精製することができる。

(T法) 化合物 (XXXXI-1)または化合物 (XXXXI-2)は次の方法でも製造することができる。

一般式 (XXXXIV)

 $\text{Rv}(\text{CH}_2)_{\beta}$ -X- $(\text{CH}_2)_{\alpha}$ G または Rw-OCH₂G (XXXXIV-1) (XXXXIV-2)

(式中、Rv、Rw、G、X、 α 、 β は前記と同義である。)で表される化合物 (以下、化合物 (XXXXIV-1) または化合物 (XXXXIV-2) という)と化合物 (III) を塩基の存在下縮合させ、一般式 (XXXXV)

$$COOY$$
 $COOY$ $COOY$ $COOY$ $COOY$ $COOY$ CH_2 CH_2

(式中、R v 、R v 、 R v 、

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、プチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔54,0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXXXV-1)または化合物 (XXXXV-2)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常-20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

カルボキシの還元反応の反応時間は、通常30分間から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXXI-1)または化合物(XXXXI-2)を精製することができる。

(U法) 化合物 (XIV)に一般式 (XXXXVI)

$$(R^1)_nM$$
 、 $(Rr)_nM$ または $(Rs)_nM$ (XXXXVI-1) (XXXXVI-2) (XXXXVI-3)

(式中、R¹、Rr、Rs、M、nは前記と同義である。)で表される化合物 (以下、化合物 (XXXXVI-1)、化合物 (XXXXVI-2) または化合物 (XXXXVI-3) という)を付加させ、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、一般式 (XXXXVI)

(式中、 R^1 、Rr、Rs、 Q^1 、 Q^2 、 Z^1 、 Z^2 、Za は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXXXVII-1)、化合物(XXXXVII-2)または化合物(XXXXVII-3)という〕とした後、必要に応じて保護基を除去することにより化合物(XXII-1)、化合物(I-22)または化合物(I-23)を製造することができる。

付加反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

付加反応の反応温度は、通常-100~80℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

付加反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により付加反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXXVII-1)、化合物(XXXXVII-2)または化合物(XXXXVII-3)を精製することができる。

このように本方法は、一般式 (I-21)~(I-23)の化合物の合成に適用することができる。

(V法)一般式(XXXXVIII)

(式中、Yは前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XXXXVIII))という〕と化合物(II)を塩基の存在下縮合させ、一般式(XXXXIX)

(式中、R¹、Yは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XX XXIX)という〕とした後、一般式(XXXXX)

$$H_2 N - Le$$
 (XXXXX)

(式中、Leは2, 4-ジニトロフェノキシなどの脱離基を示す。)で表されるアミノ化剤を塩基の存在下作用させることにより、一般式(XXXXXI)

(式中、R¹、Yは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XX XXXI)という〕とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより、化合物(I-29)を製造することができる

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、プチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上 またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXXIX)を精製することができる。

アミノ化反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウ ムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リ チウムジイソプロピルアミド、プチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザ ン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ 〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

アミノ化反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール 、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレン グリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、 ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジ クロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

アミノ化反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ 以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

アミノ化反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に 応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件によりアミノ化反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXXXI)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級プチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常 - 20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

カルボキシの還元反応の反応時間は、通常30分間から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (I-29) を精製することができる。

本方法は、一般式(I-1)~(I-18)の化合物の合成に適用することができる。好ましくは一般式(I-12)または(I-13)の化合物の合成に適用することができる。

Ĺj

· (W法)

;

本発明の一般式(I)の化合物中、Rが-CH(OH)Rrである化合物は、 一般式

$$CH_2OH$$
 $H_2N \longrightarrow C \longrightarrow CO_2H$
 $CH(OH)Rr$
 $(XXXXXII)$

(式中、Rr は前記と同義である。)により表される化合物(以下、化合物(XXX XXII)と称する)またはそのカルボキシル基における誘導体、またはRr におけるアルキル基(鎖中に二重結合またはカルボニルを有していてもよい)のα位が水酸基で置換された化合物(XXXXXII)においては、相当するラクトン化合物、あるいは化合物(XXXXXII)またはラクトン化合物のアミノまたは水酸基が保護基により保護された化合物をそれ自体公知の還元反応、水素添加反応またはオゾン分解反応もしくは酸化反応を単独または任意に組合わせて行うことにより製造される。

化合物(XXXXXII) のカルボキシル基における誘導体としては、エステル(メチルエステル、エチルエステル、ベンジルエステル、p-ニトロベンジルエステル、トリメチルシリルエステル、第3級プチルジメチルシリルエステル等)、酸ハライド(酸塩化物等)、酸無水物、混合酸無水物等が挙げられる。

化合物(I)において、Rrがα位水酸基置換アルキル基である化合物の場合、 上記したラクトン化合物を出発原料として用いるのが好ましい。

還元反応は、通常錯金属水素化物の存在下、反応に不活性な溶媒中、冷却下から還流下までの温度で進行する。用いうる錯金属水素化物としては水素化アルミニウム、水素化アルミニウムリチウム、水素化アルミニウムリチウムー塩化アルミニウム、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム、ビス(2-メトキシエトキシ)水素化アルミニウムナトリウム、ジイソブチル水素化アルミニウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化ホウ素などが挙げられ、溶媒としてはアルコール系溶媒(メタノール、エタノール、イ

・ソプロパノール、ジエチレングリコール等)、炭化水素系溶媒(ベンゼン、トルエン、キシレン等)、ハロ炭化水素系溶媒(塩化メチレン、ジクロロエタン、クロロホルム等)、エーテル系溶媒(ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、テートラヒドロフラン、ジオキサン等)、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキンド等が挙げられる。これらは単独で用いてもよいし、併用することも可能である。

また、還元反応は亜鉛-塩酸飽和無水酢酸、銅クロマイト触媒、パラジウム-炭素、ラネーニッケル、酸化レニウム等を用いた接触還元法や電解還元法も適用 可能である。これらの反応もそれ自体公知の反応に準じて進行する。

水素添加反応は、通常パラジウム系、ニッケル系、白金系等の慣用の触媒を用いるそれ自体公知の方法により進行する。反応には不活性な溶媒を用いうるが、 そのようなものとしては上記した溶媒が例示される。

本発明においては、上記反応において得られた化合物を原料として用いることができる。

化合物(XXXXXII) 中、Rr がα位水酸基置換アルキル基(鎖中に二重結合また。はカルボニルを有していてもよい)である化合物、そのラクトン化合物は、前記した特開平1-104087号公報および特開平3-128347号公報により公知であり、それら公報に記載された方法により製造される。化合物(XXXXXII)中、Rr が鎖中に二重結合またはカルボニルを有していてもよいアルキル基(たとえば、ヘプタデシル)である化合物は、たとえば発酵法またはそれにより生産され、式

$$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{OH} \\ \text{H}_2\text{N} \longrightarrow \overset{|}{\text{C}} \longrightarrow \text{CO}_2\text{H} \\ \text{CH}(\text{OH}) \text{(CH}_2)_2\text{CH} = \text{CH}(\text{CH}_2)_6\text{C(CH}_2)_5\text{CH}_3 \end{array} \tag{XXXXXIII)}$$

により表される化合物(XXXXXIII)を出発物質として用いることにより製造されうる。化合物(XXXXXIII)を生産しうる微生物としては、子のう菌類や不完全菌に属するもの、具体的には不完全菌に属するイザリア属、マイセリア属、子のう菌に

属するマイリオコッカム属(チエラビア属)等が挙げられ、それぞれアメリカン・タイプ・カルチュア・コレクション(American Type Culture Collection)にイザリア・シンクレイリー(Isaria sinclairii)ATCC No. 24400、マイリオコッカム・アルボマイセス(Myriococcum albomyces)ATCC No. 16425、マイセリア・ステリリア(Mycelia sterilia)ATCC No. 20349として寄託されている。また、マイリオコッカム・アルボマイセスATCC No. 16425は(財)発酵研究所(大阪)にIF032292として寄託されている。

化合物(XXXXXIII)は上記菌株を、たとえば常用される紫外線、高周波放射線、 薬品等による人工変異手段で変更した変異株にて製造することもできる。

化合物(XXXXXIII)生産菌は、通常のかび用栄養源を含む種々の培養基で培養される。たとえば、炭素源としてグルコース、澱粉、グリセリン、糖水あめ、デキストリン、糖蜜、マルトース、キシロース等、および窒素源としてコーンスティープリカー、ペプトン、イーストエキス、ジャガイモ煎汁、肉汁、大豆粉、小麦胚芽、硝酸カリウム、硝酸ナトリウム、硫酸アンモニウム、カゼイン、グルテンミール、綿実粉、羽毛粉等の無機または有機の窒素化合物が挙げられ、その他通常の無機塩および菌の発育を助け、化合物(XXXXXIII)の生産を促進する有機および無機物や消泡剤等の培養に常用される添加剤を適当に加えることができる。

培養法は特に限定されるものではないが、好気的な深部培養法が適している。 培養に適当な温度は、イザリア属に属する菌の場合には $20 \sim 35 \, ^{\circ} ^{\circ} ^{\circ}$ 、好適には $25 \sim 30 \, ^{\circ} ^{\circ} ^{\circ} ^{\circ}$ であり、マイリオコッカム属またはマイセリア属に属する菌の場合 には $30 \sim 50 \, ^{\circ} ^{\circ} ^{\circ}$ 、好適には $35 \sim 45 \, ^{\circ} ^{\circ} ^{\circ}$ である。

培養物中に生産された化合物(XXXXXIII)は抽出、吸着等常用される操作を必要に応じて適宜組み合わせ、培養物中より取り出される。たとえば、イザリア・シンクレイリー等のイザリア属に属する菌の場合は培養液から菌体等の不溶物を濾過、遠心分離等の方法で分離し、培養濾液をアンバーライトXAD-2(商品名)に通液させ、化合物(XXXXXIII)を吸着させることによって取り出される。かくして得られた化合物(XXXXXXIII)をさらに、例えばメタノールで溶出させ、溶出部をさらに逆相クロマトグラフィーにかけて分画することによって化合物(XXXXXIII)

;;

の高度精製物が得られる。また、マイリオコッカム・アルボマイセス、マイセリア・ステリリア等のマイリオコッカム属またはマイセリア属に属する菌の場合は、培養液から菌体を濾過、遠心分離等の方法で分離し、培養濾液はイザリア属と同様に操作する。一方、分離した菌体からは、メタノールを用いて化合物(XXXXXIII)を抽出し、抽出液を濾液と同様にアンバーライトXAD-2で処理し、クロマトグラフィーや再結晶により精製し、化合物(XXXXXIII)を得る。

本発明の2-アミノー1、3-プロパンジオール化合物、その異性体またはそれらの塩はすぐれた免疫抑制作用を示し、ヒト、ウシ、ウマ、イヌ、マウス、ラット等の哺乳動物に対して、たとえば臓器や骨髄移植の際の拒絶反応の抑制剤や、関節リウマチ、アトピー性湿疹(アトピー性皮膚炎)、ベーチェット病、ブドウ膜病、全身性エリテマトーデス、シューブレン病、多発性硬化症、重症筋無力症、I型糖尿病、内分泌性眼障害、原発性胆汁性肝硬変、クローン病、糸球体腎炎、サルコイドーシス、乾癬、天疱瘡、再生不良性貧血、特発性血小板減少性紫斑病、アレルギー、結節性多発動脈炎、進行性全身性硬化症、混合性結合組織病、大動脈炎症候群、多発性筋炎、皮膚筋炎、Wegner肉芽腫、潰瘍性大腸炎、活動性慢性肝炎、自己免疫性溶血性貧血、Evans症候群、気管支喘息、花粉症等の自己免疫疾患等における予防または治療剤として、あるいは医学、薬学における試薬として用いることができる。また、保護基により保護された化合物は、これらすぐれた薬理作用等を有する化合物の合成中間体として有用である。

これらの化合物類を医薬として用いる場合、通常その有効成分量を担体、賦形 剤、希釈剤等と混合して散剤、カプセル剤、錠剤、注射剤等に製剤化して患者に 投与することができる。また、それ自体既知手段にて凍結乾燥製剤としてもよい。

これらの化合物類の投与量は疾患、症状、体重、性別、年齢等によって変わり うるが、例えば腎移植における拒絶反応の抑制には、通常成人1日当たり0.0 1~10mg(力価)を1日1~数回に分けて投与される。

また、本発明の化合物は、シクロスポリン、アザチオプリン、ステロイド剤、 FK-506(EP-A184162公報)等の免疫抑制剤と併用することができる。

以下、実施例により本発明を具体的に説明するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

実施例1

ž

(1) 2-アセトアミドマロン酸ジエチル3.0gを乾燥エタノール50m1に溶解し、これにナトリウムエトキシド1.13gを加えた。この混合溶液に室温で撹拌しながら、テトラデシルプロマイド4.7gを乾燥エタノール20m1に溶解した溶液を加えた。反応器内を窒素で置換し、約15時間還流した後、1N塩酸水溶液で中和し濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-テトラデシルマロン酸ジエチル3.5gを得た。

融点=58.5~60.5℃

IR (KBr): 3280, 2970, 2930, 2860, 1750, 1655, 1525, 1480, 1220, 1030 cm⁻¹

(2) 2-アセトアミド-2-テトラデシルマロン酸ジエチル3.40gを乾燥テトラヒドロフラン200m1に溶解し、塩化カルシウム管をつけ、氷水浴中で水素化アルミニウムリチウム1.58gを加え、撹拌した。その後、室温で30分撹拌した後、水3.0m1を加えて反応を停止した。反応混合液を減圧下に濃縮し、濃縮残渣に無水酢酸100m1、ピリジン80m1を加えて室温で一夜撹拌した。反応混合物を氷水に投じて全容を1600m1とし、これを酢酸エチル500m1で3回抽出した。酢酸エチル層を合わせ、1N塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで脱水後、濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-テトラデシルプロパン1.35gを得た。

融点=84.0~85.5℃

IR (KBr): 3310, 2950, 2920, 2840, 1750, 1655, 1550, 1470, 1375, 1255, 1230, 1035, 900 cm⁻¹

実施例 2

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-テトラデシルプロパン1. 2 5 gをメタノール100m1に溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液19. 4m 1を加えて、6時間加熱還流した。1N塩酸水溶液で中和した後、減圧下に濃縮し、濃縮残渣を水、酢酸エチル:ヘキサン=1:1で順次洗浄し、2-アミノ-2-テトラデシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩791mgを得た。

融点=96.5~98.5℃

Rf:0.55(2)0.000 Rf:0.55(2) R

IR (KBr): 3520, 3450, 3300, 3050, 2920, 2850, 1630, 1530, 1470, 1290, 1070, 1050 cm⁻¹

実施例3

(1) 2-アセトアミドマロン酸ジエチル3.0gを乾燥エタノール50m1に溶解し、これにナトリウムエトキシド1.13gを加えた。この混合溶液に室温で撹拌しながら、ヘキサデシルプロマイド5.5gを乾燥エタノール20m1に溶解した溶液を加えた。反応器内を窒素で置換し、約15時間還流した後、1N塩酸水溶液で中和し濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-ヘキサデシルマロン酸ジエチル4.37gを得た。

融点=65.0~67.0℃

IR (KBr): 3300, 2920, 2850, 1745, 1650, 1515, 1210, 1020 cm⁻¹

(2) 2-アセトアミド-2-ヘキサデシルマロン酸ジエチル4.30gを乾燥テトラヒドロフラン200m1に溶解し、塩化カルシウム管をつけ、氷水浴中で水素化アルミニウムリチウム1.90gを加え、撹拌した。その後、室温で30分撹拌した後、水3.6m1を加えて反応を停止した。反応混合液を減圧下に濃縮し、濃縮残渣に無水酢酸100m1、ピリジン80m1を加えて室温で一夜撹拌した。反応混合物を氷水に投じて全容を1600m1とし、これを酢酸エチル50m1で3回抽出した。酢酸エチル層を合わせ、1N塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで脱水後、濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精

製し、2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-ヘキサデシルプロパン1. 83gを得た。

融点=84~86℃

IR (KBr): 3300, 2920, 2850, 1740, 1655, 1560, 1390, 1270, 1240, 1055 cm⁻¹

実施例 4

:

`_

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-ヘキサデシルプロパン1. 7 5 gをメタノール100mlに溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液23.8m 1を加えて、6時間加熱還流した。1N塩酸水溶液で中和した後、減圧下に濃縮 し、濃縮残渣を水、酢酸エチル:ヘキサン=1:1で順次洗浄し、2-アミノー 2-ヘキサデシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩892mgを得た。

融点=100.5~104.0℃

Rf:0.55 (クロロホルム:メタノール:水=65:35:5)

IR (KBr): 3350, 2920, 2850, 1590, 1470, 1050 cm⁻¹

実施例5

(1) 2-アセトアミドマロン酸ジエチル5.0gを乾燥エタノール64m1に溶解し、これにナトリウムエトキシド1.71gを加えた。この混合溶液に室温で撹拌しながら、オクタデシルプロマイド8.4gを乾燥エタノール20m1に溶解した溶液を加えた。反応器内を窒素で置換し、約15時間還流した後、1N塩酸水溶液で中和し濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-オクタデシルマロン酸ジエチル6.4gを得た。

融点=70~71℃

 $^{1}H-NMR$ (200MHz, CDCl₃) δ :

- 6.77 (1H, br.s, -NH-), 4.24 (4H, q, J=7.16Hz, -OCH₂-×2),
- 2. 35-2. 26 (2H, m, C_3 -Ha, Hb), 2. 03 (3H, s, CH_3 CONH-),
- 1.25 (38H, m, 0-CH₂ -CH₃ \times 2, CH₂ \times 16),
- 0.88 (3H, t. J=6.47Hz, CH_3)

·IR: 3260, 2910, 2850, 1745, 1640, 1515, 1210, 1020 cm⁻¹

(2) 2-アセトアミド-2-オクタデシルマロン酸ジエチル3.0gを乾燥テトラヒドロフランに溶解し、塩化カルシウム管をつけ、氷水浴中で水素化アルミニウムリチウム1.2gを加え、撹拌した。その後、室温で30分撹拌した後、水2.31gを加えて反応を停止した。反応混合液を減圧下に濃縮し、濃縮残渣に無水酢酸130m1、ピリジン120m1を加えて室温で一夜撹拌した。その後、反応混合物を氷水に投じて全容を2200m1とし、これを酢酸エチル700m1で3回抽出した。酢酸エチル層を合わせ、1N塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで脱水後、濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-オクタデシルプロパン1.7gを得た。

融点=90~91℃

 $^{1}H-NMR$ (200MHz, CDCl₃) δ :

5.64 (1H, br.s, -NH-), 4.30 (4H, s, $-CH_2O-\times 2$).

2.09 (6H, s, $0COCH_3 \times 2$), 1.97 (3H, s, $NHCOCH_3$),

1.25 (34H, br.s, $CH_2 \times 17$), 0.88 (3H, t, J=6.47Hz, CH_3)

IR: 3280. 2920. 2850. 1750. 1735. 1645. 1565. 1385. 1270. 1240. 1045 cm⁻¹

実施例 6

2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-オクタデシルプロパン1.00gをメタノール26m1に溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液6.4m1を加えて、6時間加熱還流した。1N塩酸水溶液で中和した後、減圧下に濃縮し、濃縮残渣を水、酢酸エチル:ヘキサン=1:1で順次洗浄し、2-アミノ-2-オクタデシル-1,3-プロパンジオール塩酸塩639mgを得た。

融点=108.5~109.5℃

 $^{1}H-NMR$ (200MHz, CD₃ OD) δ :

3. 64 (2H. d. J=11. 48Hz. -CHa-0-).

- 3.57 (2H. d. J=11.47Hz, -CHb-0-),
- 1.28 (34H, br.s, $CH_2 \times 17$),
- 0.90 (3H, t, J=6.35Hz, -CH₃)

IR: 3275, 2900, 2840, 1630, 1600, 1530, 1465, 1290, 1050 cm⁻¹ 実施例 7

実施例5で得られた2-アミノ-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩100mgをメタノール200mlに溶解後、ダイアイオンWA-10 (商品名;陰イオン交換樹脂)50mlに滴液した。溶出液の溶媒を留去し、2-アミノ-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール64mgを得た。

融点=76.0~80.0℃

IR: 3290, 3175, 2910, 2850, 1590, 1580, 1480, 1065, 1050, 1000 cm⁻¹ 実施例 8

(1) 2-アセトアミドマロン酸ジエチル3.0gを乾燥エタノール50m1に溶解し、これにナトリウムエトキシド1.3gを加えた。この混合溶液に室温で撹拌しながら、臭化ドコシル6.5gを乾燥エタノール20m1に溶解した溶液を加えた。反応器内を窒素で置換し、約15時間還流した。1N塩酸水溶液で中和し濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-ドコシルマロン酸ジエチル4.2gを得た。

融点=79~80℃

IR (KBr): 3300, 2925, 2860, 1750, 1655, 1520, 1220 cm⁻¹

(2) 2-アセトアミド-2-ドコシルマロン酸ジエチル4.15gを乾燥テトラヒドロフランに溶解し、塩化カルシウム管をつけ氷水浴中で水素化アルミニウムリチウム1.4gを加え撹拌した。室温で30分撹拌した後、水2.31gを加え反応を停止した。反応混合物を減圧下に濃縮し、濃縮残渣に無水酢酸130m1、ピリジン120m1を加えて室温で一夜撹拌した。その後、反応混合物を氷水に投じて全容を2200m1とし、これを酢酸エチル700m1で3回抽出した。酢酸エチル層を合わせ、1N塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで脱水後濃縮し、

濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、2-アセトアミドー 1,3-ジアセトキシ-2-ドコシルプロパン1.8gを得た。

融点=94~95℃

IR (KBr): 3280, 2920, 2850, 1750, 1655, 1520, 1480, 1220 cm⁻¹ 実施例 9

2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-ドコシルプロパン1.5gをメタノール40m1に溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液9.6m1を加えて6時間加熱還流した。1N塩酸水溶液で中和した後、減圧下に濃縮し、濃縮残渣を水、酢酸エチル:ヘキサン=1:1で順次洗浄し、2-アミノ-2-ドコシル-1,3-プロパンジオール塩酸塩846mgを得た。

融点=109.0~110.5℃

Rf: 0.55 (クロロホルム:メタノール:水=65:35:5)
IR(KBr): 3500, 3450, 3290, 2920, 2850, 1640, 1530, 1470, 1060 cm⁻¹
実施例10

(1) 2-アセトアミドマロン酸ジエチル3.0gを乾燥エタノール50m1に溶解し、これにナトリウムエトキシド1.3gを加えた。この混合溶液に室温で撹拌しながら、臭化エイコシル6.0gを乾燥エタノール20m1に溶解した溶液を加えた。反応器内を窒素で置換し、約15時間還流した後、1N塩酸水溶液で中和し濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-エイコシルマロン酸ジエチル4gを得た。

融点=76.5~77.5℃

IR (KBr): 2920, 2850, 1750, 1655, 1520, 1480, 1220 cm⁻¹

(2) 2-アセトアミド-2-エイコシルマロン酸ジエチル3.7gを乾燥テトラヒドロフランに溶解し、塩化カルシウム管をつけ、0℃に冷却した。これに水素化アルミニウムリチウム1.4gを加え撹拌した。その後室温で30分撹拌した後、水2.31gを加え反応を停止した。反応混合物を減圧下に濃縮し、濃縮残渣に無水酢酸130m1、ピリジン120m1を加えて室温で一夜撹拌した。その後、反応混合物を氷水に投じて全容を2200m1とし、これを酢酸エチル7

00mlで3回抽出した。酢酸エチル層を合わせ、1N塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで脱水後濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-エイコシルプロパン1.7gを得た。

融点=93~94℃

IR (KBr): 3280, 2920, 2855, 1775, 1755, 1650, 1565, 1480, 1385, 1270, 1245, 1045 cm⁻¹

実施例11

٠.

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-エイコシルプロパン1.5g をメタノール40m1に溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液9.6m1を加え て6時間加熱還流した。反応液を1N塩酸水溶液で中和した後、減圧下に濃縮し、 濃縮残渣を水、酢酸エチル:ヘキサン=1:1で順次洗浄し、2-アミノ-2-エイコシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩817mgを得た。

融点=109.5~111.0℃

Rf:0.55(クロロホルム:メタノール:水=65:35:5) IR(KBr):3300,2910,2850,1640,1600,1480,1065,1050 cm⁻¹ 実施例12

(1) 2-アセトアミドマロン酸ジエチル15gを乾燥エタノール200m1に溶解し、これにナトリウムエトキシド5.6gを加えた。この混合溶液に室温で撹拌しながら、9-オクタデセニルクロライド22gを加え、反応器内を窒素で置換し、約15時間還流した。その後、エタノールー濃塩酸(11:1)で中和し濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-(9-オクタデセニル)マロン酸ジエチル1.3gを無色油状粘稠物として得た。

 $^{1}H-NMR$ (200MHz, CDCl₃) δ :

- 6.765 (1H, br.s, -NH-), 5.340-5.310 (2H, m, CH=CH).
- 4. 240 (4H, q. J=7. 4Hz, -0CH₂ $\times 2$), 2. 032 (3H, s, CH₈ CON).

- 1.990 (4H, m, $CH_2CH=\times 2$), 1.252 (26H, m, $CH_2\times 13$),
- 1.252 (6H, t, J=7.2Hz, $OCH_2 CH_3 \times 2$),
- 0.880 (3H, t, J=6.5Hz, CH_3)
- (2) 2-アセトアミド-2-(9-オクタデセニル)マロン酸ジエチル1.3g を乾燥テトラヒドロフラン30mlに溶解し、氷冷下、水素化アルミニウムリチウム450mgを加え、乾燥窒素で反応器内を置換し、撹拌した。その後、室温で2時間撹拌し、水1mlを加えて反応を停止した。この反応混合液を減圧下に濃縮し、濃縮残渣に無水酢酸10ml、ピリジン5mlを加えて室温で一夜撹拌した。その後、反応混合液に氷冷下、水を加えて全容を約100mlとし、これを酢酸エチル50mlで2回抽出した。酢酸エチル層を合わせ、1N塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで脱水後、濃縮し、2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシー2-(9-オクタデセニル)プロパン430mgを無色油状粘稠物として得た。IR(CHCl₃):3460,3420,3010,2940,2860,1750,1690,1520,1475,

実施例13

2-rセトアミド-1, 3-ジrセトキシ-2-(9-オクタデセニル)プロパン332mgをメタノール30m1に溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液7.8m1を加えて、一夜加熱環流した。その後、メタノールー濃塩酸(11:1)で中和し、減圧下濃縮した。濃縮残渣をメタノールー水(1:1)に溶解し、逆相カラムクロマト〔充塡剤:Sep-Pak(C₁₈)〕に付し、水洗した後、メタノールで溶出した。その溶出液を濃縮し、<math>2-rミノ-2-(9-オクタデセニル)-1, $3-プロパンジオール塩酸塩209mgを無色油状粘稠物として得た。
<math>^1H-NMR(200MHz, CD_8, 0D)\delta$:

1390, 1380, 1240(br), 1045, 990 cm $^{-1}$

- 5. 385-5. 315 (2H, m, CH=CH), 3. 616 (2H, d, J=11. 4Hz, $0CH_{2a} \times 2$),
- 3.548 (2H, d, J=11.4Hz, $0CH_{2b} \times 2$).
- 2.071-1.957 (4H, m, $CH_2CH=\times 2$), 1.655-1.580 (2H, m, CCH_2).
- 1.39-1.28 (24H, m, $CH_2 \times 12$), 0.896 (3H, t. J=6Hz, CH_3)

IR: 3300(br), 2920, 2850, 1600, 1500, 1465, 1050, 965 cm⁻¹ 実施例 1 4

(1) 無水エタノール15m1に氷冷下、ナトリウム0.23gを加え、窒素ガス 気流下、室温で30分間撹拌し、ナトリウムエトキシドのエタノール溶液10mmo1を調製した。この溶液に、2-アセトアミドマロン酸ジエチル1.98gを加え、窒素気流下30分間、50℃で加熱した後、室温で3-フェニルプロピルブロマイドを加え、24時間加熱還流した。希塩酸で中和し、エタノールを留去した残渣を酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:4~1:1)にて精製し、ジイソプロピルエーテルーヘキサンで再結晶し、2-アセトアミドー2-(3-フェニルプロピル)マロン酸ジエチル800mgを白色結晶として得た。

融点=76~77℃

Rf:0.58(酢酸エチル:ヘキサン=1:1)

 $^{1}H-NMR$ (90MHz, CDCl₃) δ :

1.22 (3H, t, J=7Hz), 1.10-1.56 (4H, m), 2.02 (3H, s),

2.28-2.75 (2H, m), 4.21 (4H, q, J=7Hz), 6.75 (1H, br.s),

7. 02-7. 42 (5H, m)

I R ν : 3259, 2980, 2863, 1738, 1648 cm⁻¹

 $MS (EI) : 335(M^{+})$

(2) 上記化合物 1. 0gと水素化ホウ素リチウム 1 3 6 mgのテトラヒドロフラン溶液 5 0 m 1 を窒素気流下、1時間加熱還流した。反応液を 1 0 0 m 1 の氷水にあけ、酢酸エチルにて抽出後、洗浄、乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(メタノール:クロロホルム= 1:20)で精製し、2-アセトアミド-2-(3-フェニルプロピル)-1,3-プロパンジオール 7 2 0 mgを無色油状物質として得た。

Rf:0.30(酢酸エチル)

 $^{1}H-NMR$ (90MHz, CDCl₃) δ :

1.47-1.89 (4H, m), 2.00 (3H, s), 2.44-2.84 (2H, m).

3.73 (4H, dd, J=7Hz, 15Hz), 3.37-4.17 (2H, m),

5.51-5.97 (1H, m), 7.00-7.45 (5H, m)

I R ν : 3294. 2938. 1652 cm⁻¹

 $MS (E I) : 251(M^{+})$

実施例 15

 $^{1}H-NMR$ (90MHz, CDCl₃) δ :

1.11-1.98 (4H, m), 2.43-2.75 (2H, m), 3.15-4.03 (4H, m).

3. 62 (4H, br. s), 7. 19 (5H, s)

I R ν : 3347, 3023, 2937, 1583 cm⁻¹

MS (E I) : 209 (M+1)

実施例16

(1) 臭化シンナミル5. 42g、2-rehrミドマロン酸ジエチル5. 43g およびナトリウムエトキシド1. 87gのエタノール70m1溶液を窒素下、2 時間加熱還流した。200m1の氷水にあけ、酢酸エチルにて抽出後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(酢酸エチル: 2-rehr) にて精製し、2-rehr) にて精製し、2-rehr) マロン酸ジエチル2. 2-rehr0 にて得た。

融点=70~75℃

·Rf:0.38(酢酸エチル:ヘキサン=1:5)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1.31 (6H, t, J=7.5Hz), 1.56 (2H, s), 2.09 (3H, s),

4.28 (4H, q, J=7.5Hz), 6.30-6.80 (2H, m), 7.27 (5H, s)

IR(KBr): 3280, 2990, 1740, 1640 cm⁻¹

(2) 上記化合物 2. 5 0 gと水素化ホウ素リチウム 1. 6 3 gのテトラヒドロフラン溶液 8 0 m 1 を窒素気流下、 2 時間加熱還流した。反応後溶媒を留去し、乾固した。残渣に無水酢酸 1 4 m 1 とピリジン 5 0 m 1 を加え、一夜室温で撹拌した。氷水にあけ酢酸エチルにて抽出した。抽出液を 2 N 塩酸、飽和重曹水、飽和食塩水にて順次洗浄した後、乾燥して溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル: ヘキサン= 3:1)にて精製して、 2 ーアセトアミドー 1, 3 ージアセトキシー 2 ー (3 ーフェニルー 2 ープロペニル)プロパン 2 0 0 m g を白色結晶として得た。

融点=88~90℃

Rf:0.70(酢酸エチル)

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

1.96 (3H, s), 2.07 (6H, s), 2.82 (2H, d, J=7.5Hz), 4.36 (4H, s)

IR(KBr): 3311, 3084, 1750, 1655, 1560 cm⁻¹

 $MS: 333 (M^+)$

元素分析:計算值 C 64.85, H 6.95, N 4.20

分析値 C 64.85. H 6.88. N 4.15

実施例17

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(3-フェニル-2-プロペニル) プロパン170mgをメタノール6m1に溶解し、1N水酸化ナトリウム 水溶液6m1を加えて、3時間加熱還流した。反応後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(メタノール:クロロホルム= $1:3.0\sim1:6$)にて精製し、2-アミノ-2-(3-フェニル-2-プロペニル)-1, 3-プロパンジオール70mgを淡褐色結晶として得た。

Rf: 0.14(y9)-w:000-xw=1:10

IR (KBr) : 3367, 2935, 1556 cm⁻¹

実施例18

(1) 1-フェニル-1-プロピン-3-オール5g、トシルクロライド5.1g およびピリジン20m1を室温で1時間撹拌した。氷水100m1にあけて、酢酸エチルで抽出後、油層を1N塩酸と飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:5)にて精製し、3-フェニル-2-プロピニルクロライド2.54gを淡黄色油状物質として得た。

Rf:0.81(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

4.37 (2H. s), 7.23-7.60 (5H, m)

IR (neat): 2222, 758, 690 cm⁻¹

 $MS(70eV): 150(M^+)$

(2) 上記化合物 2. 5g、2-rセトアミドマロン酸ジメチル 3. 79gおよびナトリウムエトキシド 1. 43gのエタノール 50m 1 溶液を窒素下、 3 時間加熱還流した。 20m 1 の水で反応を停止し、酢酸エチルで抽出後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル: 01 : 02 : 03 - 03 - 03 - 04 : 05 : 05 : 06 : 06 : 07 : 08 : 09 :

融点=94~96.5℃

Rf:0.38(酢酸エチル:ヘキサン=1:2))

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

1.28 (6H, t, J=7.5Hz), 2.08 (3H, s), 3.49 (2H, s),

4.30 (4H, q, J=7.5Hz), 6.98 (1H, br.s), 7.16-7.49 (5H, m)

I R (KBr) : 3260, 1747, 1643, 1197 cm⁻¹

 $MS(70eV): 331 (M^+)$

(3) 上記化合物 1. 8 g と水素化ホウ素リチウム 0. 4 7 g のテトラヒドロフラン溶液 5 0 m 1 を窒素下、1. 5 時間加熱還流した。放冷後、1 N塩酸水溶液 8 m 1 にて中和し、乾固した。残渣に無水酢酸 4 m 1 とピリジン 3 0 m 1 を加え、室温にて 2. 5 時間撹拌した。反応液を氷水にあけクロロホルムで抽出し、抽出液を 1 N塩酸、飽和食塩水にて順次洗浄し、乾燥後溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン= 2 : 1)にて精製し、2 - アセトアミド-1, 3 - ジアセトキシー 2 - (3 - フェニルー 2 - プロピニル)プロパン 4 3 0 m g を無色油状物として得た。

Rf:0.64(酢酸エチル)

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

1.98 (3H. s), 2.07 (6H. s), 3.09 (2H. s), 4.47 (4H. s),

5. 95 (1H. br.s), 7. 18-7. 48 (5H, m)

IR (neat): 3293, 2135, 1745, 1662 cm⁻¹

 $MS(70eV): 331(M^+)$

実施例19

2-rセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(3-フェニル-2-プロピニル) プロパン 430 m g を y タノール 8 m 1 に溶解し、1 N 水酸化ナトリウム 水溶液 8 m 1 を加え、2 時間加熱還流した。溶媒を留去後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(y タノール: クロロホルム= $1:50\sim1:7$)にて精製して、2-rミノー2-(3-フェニル-2-プロピニル)-1, 3-プロパンジオール <math>230 m g を 淡黄色 y モルファス様 固体として得た。

Rf: 0.20 (yy)-u:0 = 1:5)

IR (KBr) : 3281, 2932, 1558, 1049 cm^{-1}

実施例20

(1) 4-(4-ブチルフェニル) ブタノール1.1g、トシルクロライド1.0 5g、ピリジン0.48m1と触媒量のジメチルアミノピリジンのジクロロメタン溶液を室温で一夜放置した。氷水50m1にあけて、クロロホルムにて抽出後無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロ

マトグラフィー(酢酸エチル: $^{+}$ サン=1:6)にて精製し、 4 ー (4 ープチルフェニル)プチル $^{-}$ $^{-}$ トルエンスルホナート1. 2 8 1 4 g を無色油状物質として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

0.96 (3H, t, J=7Hz), 1.50-2.00 (8H, m), 2.48 (3H, s),

2.40-2.75 (4H, m), 4.08 (2H, t, J=6Hz), 7.07 (4H, m).

7. 36 (2H. d. J=8Hz). 7. 83 (2H. d. J=8Hz)

IR: 2956, 2929, 2858, 1361 cm⁻¹

 $MS: 360(M^{+})$

(2) 上記化合物 1. 2 1 3 8 gとヨウ化ナトリウム 0. 6 0 6 gを2 - ブタノン 3 4 m 1 に溶解し、4 時間加熱還流した。氷水 1 0 0 m 1 にあけて、酢酸エチル にて抽出後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:9)にて精製し、4 - (4-プチルフェニル)-1-ヨードブタン 0. 9 5 3 gを赤色油状物質として得た。

Rf:0.75(酢酸エチル:ヘキサン=1:5)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

0. 92 (3H. t. J=7Hz). 1. 10-2. 05 (8H. m). 2. 59 (4H. t. J=7.5Hz),

3. 20 (2H, t, J=7Hz), 7. 07 (5H, s)

(3) 上記化合物 9 5 3. 4 mg、2 - 7 vert 7 vert 7 vert 1 vert $1 \text{ ver$

融点=60~61℃

Rf:0.38(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 \cdot ¹H-NMR (CDCl₃ /TMS) δ :

0.93 (3H, t, J=6Hz), 1.24 (3H, t, J=7Hz), 1.09-1.85 (8H, m),

2.02 (3H, s), 2.35 (2H, m), 2.58 (4H, t, J=7.5Hz),

4.25 (2H. q. J=6Hz), 6.75 (1H. br.s), 7.07 (4H. s)

IR: 3270, 2930, 2850, 1740, 1640 cm⁻¹

 $MS: 405(M^+), 290$

元素分析:計算值 C 68.12, H 8.70, N 3.45

分析值 C 68.25, H 8.69, N 3.55

(4) 上記化合物 4 5 0 m g と水素化ホウ素リチウム 1 0 0 m g のテトラヒドロフラン溶液 1 5 m 1 を窒素下、 2 時間加熱還流した。 2 N塩酸水溶液 2.5 m 1 にて中和した後、乾固した。残渣に無水酢酸 2 m 1 とピリジン 4 m 1 を加え、一夜、室温で撹拌した。氷水にあけ酢酸エチルにて抽出した。抽出液を 2 N塩酸、飽和重曹水、飽和食塩水にて順次洗浄した後、乾燥して溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル: ヘキサン= 3:1)にて精製して、 2 ーアセトアミドー 1,3 ージアセトキシー 2 ー [4 ー (4 ープチルフェニル)プチル]プロパン 7 2.4 m g を白色結晶として得た。

融点=68~71℃

Rf:0.63(酢酸エチル)

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

0.91 (3H. t. J=7Hz), 1.10-2.40 (10H. m), 1.93 (3H. s).

2.06 (6H, s), 2.58 (4H, t, J=7.5Hz), 4.28 (4H, s),

5.62 (1H. br.s). 7.07 (4H. s)

IR: 3298, 3090, 2931, 2859, 1739, 1652, 1557 cm⁻¹

 $MS: 405(M^{+})$

元素分析:計算值 C 68.12, H 8.70, N 3.45

分析值 C 67.95, H 8.52, N 3.44

実施例21

融点=92~94℃

Rf: 0.15 (y9) - h: 0 = 1:4)

IR: 3276, 2928, 2858, 1560 cm⁻¹

実施例22

(1) $4-(4-\Lambda+\nu)$ ルフェニル)ブタノール 5. 0 gをピリジン 2 0 m 1 に溶解し、トシルクロライド 4. 8 8 gを加えた。反応液を室温で終夜放置した。氷水にあけ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を 2 N 塩酸、飽和重曹水、飽和食塩水にて順次洗浄し、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル: $\Lambda++\nu=1:7$)にて精製して、 $4-(4-\Lambda+\nu)$ ルフェニル)ブチル p-トルエンスルホナート 2. 2 1 gを無色油状物質として得た。

Rf:0.35(酢酸エチル:ヘキサン=1:5)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

0.90 (3H, t, J=6Hz), 1.09-1.85 (12H, m), 2.46 (3H, s),

2.53 (4H. m), 4.06 (2H. t, J=6Hz), 7.06 (4H. s).

7. 34 (2H, d, J=8Hz), 7. 81 (2H, d, J=8Hz)

IR: 2927, 2856, 1599 cm⁻¹

 $MS: 388(M^+). 216$

元素分析:計算值 C 71.10, H 8.30

分析值 C 71.35, H 8.34

(2) 上記化合物 2. 21gとヨウ化ナトリウム 1. 02gを2-ブタノン57m 1に溶解し、2時間加熱還流した。氷水にあけて、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄後、乾燥して濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:9)にて精製して、4-(4-ヘキシ

ルフェニル)-1-ヨードプタン1.7650gを無色油状物質として得た。

Rf:0.43(酢酸エチル:ヘキサン=1:5)

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

0.90 (3H, t. J=6Hz), 1.05-2.05 (12H, m), 2.60 (4H, m),

3.21 (2H. t. J=7Hz), 7.10 (4H, s)

 $MS: 344(M^+), 273, 175$

元素分析:計算值 C 55.82, H 7.32

分析值 C 55.81, H 7.32

融点=57~58℃

Rf:0.42(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₂ /TMS) δ :

0.91 (3H, t, J=6Hz), 1.24 (6H, t, J=7Hz), 1.08-1.90 (12H, m),

2.02 (3H, s), 2.35 (2H, m), 2.58 (4H, t, J=7Hz),

4. 23 (4H, q, J=7Hz), 6. 74 (1H, br. s), 7. 07 (4H, s)

IR: 3270, 2927, 2858, 1746, 1644, 1514 cm⁻¹

 $MS: 433(M^+), 360, 318$

元素分析:計算值 C 69.25, H 9.07, N 3.23

分析値 C 69.44, H 8.97, N 3.26

(4) 上記化合物 8 4 0 m g と水素化ホウ素リチウム 2 1 1 m g のテトラヒドロフラン溶液 2 0 m 1 を窒素下、4 時間加熱還流した。2 N 塩酸で中和後、溶媒を留去して乾固した。残渣を無水酢酸 5.5 m 1 とピリジン 1 6 m 1 に溶解し、室温で一夜撹拌した。常法処理して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフ

ィー(酢酸エチル: $^{+}$ ヤン=3:1)にて精製して、 2 ーアセトアミドー1, 3 ージアセトキシー 2 ー 4 ー 4 ー 4 ー 4 ー 5 m g を白色結晶として得た。

融点=61~64℃

Rf:0.71 (酢酸エチル)

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

0.88 (3H, t, J=6Hz), 1.10-1.90 (14H, m), 1.92 (3H, s),

2.04 (6H, s), 2.58 (4H, t, J=7Hz), 4.28 (4H, s),

5.58 (1H, br.s), 7.06 (4H, s)

IR: 3313, 2928, 2856, 1750, 1656 cm⁻¹

 $MS: 433(M^+), 389, 373$

元素分析:計算值 C 69.25, H 9.07, N 3.23

分析值 C 69.26, H 9.01, N 3.22

実施例23

2-rセトアミドー1、3-3アセトキシー $2-[4-(4-\alpha+2)$ ルフェニル)プチル]プロパン200.2mgをメタノール7m1に溶解し、1N水酸化ナトリウムを加えて、5時間加熱環流した。溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲル薄層クロマトグラフィー(メタノール:クロロホルム=1:3)にて精製して、2-rミノー $2-[4-(4-\alpha+2)$ ルフェニル)プチル]-1、3-プロパンジオール79.7mgを白色結晶として得た。

融点=99~102℃

Rf: 0.14 (y9) - u: 0 = 1:4)

IR: 3286, 2927, 2858, 1562, 1514 cm⁻¹

実施例24

(1) 濃硝酸13.94gに氷冷下、濃硫酸18.3gをゆっくり滴下し、そのまま10分間はげしく撹拌した。この混合溶液に、-20℃にてプロピルブロマイド10gをゆっくり滴下し、-20℃で1時間撹拌した。反応液を氷水500m1にあけ、エーテルにて抽出後、洗浄、乾燥後、溶媒を留去し、残渣をカラムク

ロマトグラフィー(酢酸エチル: $^{+}$ サン=1:9) にて精製し、3-(4-ニトロフェニル)プロピルプロマイド4.5 gを無色油状物質として得た。

Rf:0.33(酢酸エチル:ヘキサン=1:15)

(2) 無水エタノール40m1に氷冷下、ナトリウム0.68gを加え、窒素気流下、室温で30分間撹拌し、ナトリウムエトキシド溶液を調製した。この溶液に、2-アセトアミドマロン酸ジエチル1.98gを加え、上記(1)の化合物4.8gを滴下し、6時間加熱還流した。100m1の氷水にあけ、酢酸エチルにて抽出後、洗浄、乾燥し、溶媒を留去した残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:3~1:1)にて精製して、2-アセトアミド-2-[3-(4-ニトロフェニル)プロピル]マロン酸ジエチル3.0gを黄色油状物質として得た。

Rf:0:51 (酢酸エチル:ヘキサン=1:1)

(3) 上記(2) の化合物 1. 0 g と水素化ホウ素リチウム 2 2 8 m g のテトラヒドロフラン溶液 5 0 m 1 を窒素気流下、2 時間加熱還流した。反応液を1 0 0 m 1 の氷水にあけ、酢酸エチルにて抽出後、洗浄、乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(メタノール:クロロホルム=1:9) にて精製し、2-アセトアミド-2-[3-(4-ニトロフェニル)プロピル]ー1. 3-プロパンジオール 4 0 0 m g を黄色油状物質として得た。

Rf:0.22(酢酸エチル)

 $^{1}H-NMR$ (90MHz, CDCl₃) δ :

1.38-1.80 (4H, m), 2.00 (3H, s), 2.57-3.04 (2H, m),

3.39-4.28 (4H, m), 3.93 (2H, br.s), 6.23-6.58 (1H, m),

7.17-7.63 (2H, m), 7.75-8.20 (2H, m)

IR ν : 3301, 2944, 1652, 1519 cm⁻¹

 $MS (E I) : 296(M^{+})$

実施例25

-

ウム水溶液 6. 7 m 1 を加えて 3 時間加熱還流した後、希塩酸で中和後、溶媒を留去し、残渣にクロロホルムを加え、抽出後、クロロホルム層を洗浄、乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(メタノール:クロロホルム=1:4)で精製し、2-アミノ-2-[3-(4-ニトロフェニル)プロピル]-1,3-プロパンジオール100mgを赤色油状物質として得た。

Rf: 0.13 (2001) + 2001 + 200

 $^{1}H-NMR$ (90MHz, CDCl₃) δ :

1.10-2.05 (4H, m), 2.52-3.11 (2H, m), 3.19-3.86 (4H, m),

4.65 (4H. br.s), 7.08-7.65 (3H. m), 7.70-8.18 (1H. m)

IR ν : 3359, 2936, 2866, 1524 cm⁻¹

実施例26

(1) 3-(3-E)ドロキシフェニル)プロパノール4. 56gのエタノール溶液 30m1に、15N水酸化ナトリウム水溶液 2m1およびウンデシルプロマイド 8.0gのエタノール溶液 10m1を加え、70℃で 12 時間加熱撹拌した。溶媒を留去し、酢酸エチルにて抽出した。飽和炭酸水素ナトリウムおよび食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:20~1:3)にて精製し、3-(3-ウンデシルオキシフェニル)プロパノール7. <math>37gを無色油状物質として得た。

 $^{1}H-NMR$ (90MHz, CDCl₃) δ :

- 0.87 (3H, t, J=6Hz), 1.10-2.08 (20H, m), 1.60 (1H, br.s),
 - 2.69 (2H, t. J=6Hz), 3.55-3.81 (2H, m), 3.94 (3H, t. J=6Hz).
 - 6. 62-6. 87 (3H, m), 7. 06-7. 23 (1H, m)
- (2) 上記化合物 5 gのメチレンクロライド溶液 1 0 0 m 1 に、四臭化炭素 5. 6 8 gおよびトリフェニルホスフィン 4. 4 9 gを加え、室温で一晩撹拌した。反応液を氷水にあけ、メチレンクロライドにて抽出した。有機層を洗浄、乾燥後、溶媒を留去した。残渣に石油エーテルを加え、不溶物を濾別し、石油エーテル層を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル: ヘキサン

-1:20) にて精製し、3-(3-ウンデシルオキシフェニル) プロピルブロマイド4.6gを無色油状物質として得た。

 $^{1}H-NMR$ (90MHz, CDCl₃) δ :

- 0.83 (3H, t, J=7Hz), 1.04-1.53 (16H, m), 1.55-1.86 (2H, m),
- 2.14 (2H, m. J=7Hz), 2.70 (2H, t. J=7Hz), 3.34 (2H, t. J=7Hz),
- 3. 90 (2H, t, J=7Hz), 6. 73-6. 85 (3H, m), 7. 14-7. 42 (1H, m)

IR: 2925, 2553, 1583, 1451, 1261 cm⁻¹

(3) 無水エタノール40m1に氷冷下、ナトリウム0.43gを加え、窒素ガス気流下、室温で30分間撹拌し、ナトリウムエトキシドのエタノール溶液19mmo1を調製した。この溶液に2-アセトアミドマロン酸ジエチル4.0gを加え、窒素気流下で30分間、50℃で加熱した後、室温で上記(2)の化合物4.6gを加え、6時間加熱還流した。室温まで冷却後、希塩酸で中和し、エタノールを留去した後、残渣を酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を洗浄、乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:5~1:1)にて精製し、2-アセトアミド-2-(3-(3-ウンデシルオキシフェニル)プロピル)マロン酸ジエチル4.2gを白色結晶として得た。

融点=38~39℃

-

 $^{1}H-NMR$ (90MHz. CDCl₃) δ :

- 0.88 (3H. t. J=7Hz). 1.12-1.90 (27H. m). 2.03 (3H. s).
- 2.27-2.73 (4H, m), 3.93 (3H, t, J=7Hz), 4.22 (4H, q, J=7Hz).
- 6. 61-6. 87 (3H, m), 7. 04-7. 22 (1H, m)

IR: 3251, 2917, 1741, 1680 cm⁻¹

 $MS (E I) : 505(M^+)$

(4) 水素化アルミニウムリチウム1.08gの無水テトラヒドロフラン溶液50m1に氷冷下、上記(3)の化合物3.5gの無水テトラヒドロフラン溶液20m1を滴下し、氷冷下、1時間撹拌した。過剰の水素化アルミニウムリチウムを分解後、濾別し、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を洗浄、乾燥後、溶媒を

留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル、クロロホルム:メタノール=9:1)にて精製し、2-アセトアミドー2-(3-(3-ウンデシルオキシフェニル)プロピル)-1,3-プロパンジオール1.6gを無色油状物として得た。

 $^{1}H-NMR$ (90MHz, CDCl₃) δ :

0.86 (3H, t, J=6Hz), 1.05-1.45 (16H, m), 1.45-1.87 (6H, m),

1.99 (3H, s), 2.47-2.70 (2H, m), 3.64 (4H, dd, J=12Hz, 21Hz),

3.82 (2H, t. J=6Hz), 3.79-4.10 (2H, m), 5.89 (1H, br.s),

6.60-6.82 (3H, m), 7.03-7.31 (1H, m)

IR: 3307, 2926, 2857, 1652 cm⁻¹

MS (EI) : 421 [M+1]

実施例27

2-アセトアミド-2-〔3-〔3-ウンデシルオキシフェニル〕プロピル〕 -1,3-プロパンジオール1.4gをメタノール50m1に溶解し、1N水酸 化ナトリウム水溶液16.6m1を加えて3時間加熱還流した。氷水にあけ、希 塩酸で中和後、溶媒を留去した。残渣にクロロホルムを加えて抽出後、クロロホ ルム層を洗浄、乾燥し、溶媒を留去し、ジイソプロピルエーテルーへキサンで再 結晶し、2-アミノ-2-〔3-〔3-ウンデシルオキシフェニル〕プロピル〕 -1,3-プロパンジオール0.9gを白色結晶として得た。

融点=71~72℃

 $^{1}H-NMR$ (90MHz, CDCl₃) δ :

- 0.86 (3H, t, J=6Hz), 1.14-1.91 (22H, m), 2.20 (4H, br.s),
- 2. 60 (2H, t, J=6Hz), 3. 49 (4H, dd, J=10Hz, 13Hz),
- 3, 94 (2H, t, J=6Hz), 6, 62-6, 86 (3H, m), 7, 05-7, 21 (1H, m)

IR: 3344, 3289, 3179, 2919, 1610 cm⁻¹

 $MS (E I) : 379(M^{+})$

実施例 28:2-rミノー 2-(2-(4-x)) エチル3-x コープロパンジオール

(1) 2 - (4-オクタノイルフェニル) エチル アセテート ジクロロエタン (500ml) に、窒素気流下、塩化アルミニウム (111.

8g)を加え、室温で撹拌した。次にフェチネルアセテート(91.8g)およびデカノイルクロリド(100g)を氷冷下滴下し、室温で一晩撹拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチルエーテルにて抽出した。エーテル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:20)にて精製すると、標記化合物(61.3g、収率38%)を油状物として得た。

I R ν Neat max : 2929, 1740, 1685, 1236 cm⁻¹

(2) 2-(4-オクチルフェニル) エチル アセテート

上記化合物(24.9g)のトリフルオロ酢酸溶液(86m1)に、氷冷下、トリエチルシラン(28.8m1)を加え、室温にて2時間撹拌した。溶媒留去し、氷水を注ぎ、冷飽和重炭酸ナトリウム溶液を徐々に加えた。酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:20)にて精製することによって、標記化合物(20.5g、収率87%)を油状物として得た。

I R ν Neat max : 2927, 2855, 1742, 1237 cm⁻¹

(3) 2-(4-オクチルフェニル) エチル アルコール

上記化合物(30.3g)のメタノール(300m1)溶液に、ナトリウムメトキシド(11.9g)を加え、3時間加熱環流した。反応液を濃縮後、氷水を注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を5%HC1水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:15,酢酸エチル)にて精製すると、標記化合物(25.0g、収率97%)を油状物として得た。

I R ν Neat max : 3357, 2927, 2855, 1467 cm⁻¹

(4) 2-(4-オクチルフェニル) エチル メタンスルフォネート

上記化合物(25g)のジクロロメタン溶液(500m1)に、トリエチルアミン(16.4m1)を加え、氷冷した。これにメタンスルフォニルクロリド(13.4g)を滴下し、室温にて1時間撹拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:19)にて精製すると、標記化合物(31.6g、収率95%)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

0.86 (3H, t, J=6Hz), 1.13 - 1.79 (12H, m), 2.58 (2H, t, J=6Hz).

2.82 (3H, s), 3.01 (2H, t, J=6Hz), 4.39 (2H, t, J=6Hz),

7.12 (4H. s)

I R ν Neat max : 2926, 1356, 1174 cm⁻¹

(5) 2-(4-オクチルフェニル) エチル ヨーダイド

上記化合物(31.5g)の2-ブタノン溶液(500m1)に、ヨウ化ナトリウム(18.13g)を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:20)にて精製すると、標記化合物(27.5g、収率80%)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

0. 86 (3H, t, J=6Hz), 1.07 - 1.79 (12H, m), 2.58 (2H, t, J=6Hz)

3.01 - 3.57 (4H. m). 7.11 (4H. s)

IR ν Neat max : 2925, 2853, 1168 cm⁻¹

(6) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-オクチルフェニル) エチル マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル(26g)に窒素気流下、ナトリウムエトキシド(8.2g)の無水エタノール溶液(80m1)を滴下し、65℃で30分間

撹拌した。次に、上記化合物(13.8g)の無水テトラヒドロフラン溶液を滴下し、65℃で3時間撹拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル: $^{+}$

融点=49~51℃

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

- 0.86 (3H, t, J=6Hz), 1.14 (6H, t, J=6Hz), 1.20-1.73 (12H, m),
- 2.95 (3H, s), 2.30 2.83 (6H, m), 4.21 (4H, q, J=6Hz),
- 6.74 (1H, s), 7.05 (4H, s)

IR ν max: 3257, 2924, 1747, 1643 cm⁻¹

- (7) 2-アミノー2-〔2-(4-オクチルフェニル) エチル〕-1, 3-プロ パンジオール
- (a) リチウムアルミニウムヒドリド(3.03g)の無水テトラヒドロフラン溶液(260ml)に、窒素気流下、上記化合物(11.55g)の無水テトラヒドロフラン溶液(100ml)を氷冷下滴下し、室温で2時間撹拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え、生成した水酸化アルミニウムを濾別後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣にピリジン(40ml)を加えた。氷冷下、無水酢酸(30ml)を加え、室温で一晩放置した。反応液を水冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=2:1)にて精製し、1、3-プロパンジイル-2-アセトアミド-2-(2-(4-オクチルフェニル)エチル)イリデンジアセテート(8.25g)を白色結晶として得た。
- (b) 上記ジアセテート(8.25g)のメタノール溶液(100ml)に水酸化リチウム(7.2g)の水溶液(100ml)を加え、2時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、酢酸エチルにて再結晶することにより、融点

·103~105℃の標記化合物(4g)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (DMS0) δ :

0.86 (3H, t, J=6Hz), 1.10-1.85 (14H, m), 2.38-2.79 (6H, m),

3.39 (4H, s), 7.06 (4H, s), 7.84 (2H, brs)

IR ν : 3354, 2925, 1019 cm⁻¹

実施例29:2-アミノー2-〔2-(4-オクチルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

2-Tミノー2-(2-(4-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール(7g)を、エタノール(50m1)に溶かし、1N塩酸/エーテル溶液(<math>50m1)を加えた。溶媒を留去し、析出する結晶をエタノールにて再結晶することによって、標記化合物(4.2g)を得た。

融点=118~120℃

 $^{1}H-NMR$ (DMS0) δ :

0.89 (3H, t, J=6Hz), 1.07-1.77 (12H, m), 1.82-2.17 (2H, m).

2.42 - 2.95 (4H, m), 3.80 (4H, s), 5.03 (2H, brs), 7.11 (4H, s).

8.07 (3H. brs)

I R ν : 3371, 3265, 2924, 1069 cm⁻¹

実施例30:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔2-(4-オクチルフェニル)エチル〕-1,3-プロパンジオール

水素化リチウムアルミニウム(3.0g)の無水テトラヒドロフラン溶液(260m1)に氷冷下、ジエチル 2-rセトアミドー2-(2-(4-x)) フェニル)エチル)マロナート(11.55g)の無水テトラヒドロフラン溶液(100m1)を滴下した。氷冷下で1時間撹拌したのち、室温で2時間撹拌した。氷冷下、飽和硫酸ナトリウム水溶液を滴下し、水素化リチウムアルミニウムを分解後、濾別し、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を洗浄、乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(クロロホルム/メタノール=9/1)にて精製し、融点66~68℃の2-rセトアミドー2-(2-(4-x クチルフェニル)エチル)-1、3-プロパンジオールの結晶を得た。このもの

をピリジン(40m1)に溶かし、氷冷下、無水酢酸(30m1)を加え、室温で一夜放置した。反応液を10%塩酸水溶液(500m1)に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を炭酸水素カリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(酢酸エチル/ヘキサン=2/1)にて精製し、表題化合物(8.25g)を得た。

収率 71%

融点=105~107℃

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

0.85 (3H, t), 1.22 - 1.29 (10H, m), 1.51 - 1.61 (2H, m),

1.93 (3H, s), 2.07 (6H, s), 2.17 (2H, t), 2.54 (2H, t),

2.55 (2H, t), 4.35 (4H, s), 5.61 (1H, brs), 7.07 (4H, s)

IR (Nuiol) ν : 3310, 2920, 1738, 1652, 1556 cm⁻¹

上記実施例と同様にして、以下の化合物が製造される。

実施例31:2-アミノー2-ヘキシルー1,3-プロパンジオール塩酸塩

R f 値: 0.47 (CHCls:MeOH:CHsCOOH:H2O = 70:20:6:4)

IR (KBr): 3950, 1560, 1420, 1050 cm⁻¹

実施例32:2-アミノ-2-オクチル-1,3-プロパンジオール塩酸塩

R f 値: 0.48 (CHCl₃:MeOH:CH₃COOH:H₂O = 70:20:6:4)

IR (KBr): 3190, 2930, 2850, 1630, 1560, 1410, 1100, 1060, 1020 cm⁻¹

実施例33:2-アミノー2-デシルー1,3-プロパンジオール塩酸塩

R f 値: 0.49 (CHCl₃:MeOH:CH₃COOH:H₂O = 70:20:6:4)

IR (KBr): 3350, 2920, 2850, 1560, 1470, 1420, 1060 cm⁻¹

実施例34:2-アミノー2-ドデシルー1,3-プロパンジオール塩酸塩

IR (KBr): 3260, 3050, 2920, 2850, 1590, 1520, 1470, 1260, 1070, 1050 cm⁻¹

融点=94.0~95.5℃

実施例 3 5 : 2-アミノー2-トリデシルー1, 3-プロパンジオール塩酸塩 IR (KBr): 3420, 3320, 2400, 2350, 1620, 1590, 1510, 1465, 1085,

1045, 1030, 1000 cm⁻¹

融点=103.0~104.0℃

実施例36:2-アミノー2-ペンタデシルー1,3-プロパンジオール塩酸塩 IR(KBr):3430,3350,3030,2920,2850,1620,1590,1510.1475.

 $1080, 1055, 1040 \text{ cm}^{-1}$

元素分析 計算値 C:63.97, H:11.93, N:4.14, 0:9.47, C1:10.49 分析値 C:63.91, H:11.96, N:4.17, 0:9.45, C1:10.51

融点=106.5~108.0℃

実施例37:2-アミノ-2-(2-ペンタデシニル)-1,3-プロパンジオール塩酸塩

IR (KBr): 3400, 2920, 2850, 1500, 1470, 1060 cm⁻¹

元素分析 計算値 C:64.74, H:10.87, N:4.19, 0:9.58, C1:10.62 分析値 C:64.34, H:10.95, N:4.13, 0:9.57, C1:10.66

融点=100.0~101.0℃

本化合物は次の工程(1)~(6)のようにして製造される。

(1) 水素化ナトリウム 2. 256 gと乾燥ジメチルホルムアミド 30 m l の混合液に氷冷、窒素雰囲気下、プロパルギルアルコール 3. 00 gを少量ずつ加えた。室温にて 30分攪拌したのち、再び氷冷し、クロロメチルメチルエーテル 5. 175 gを少量ずつ加えた。さらに室温で一夜攪拌し、氷冷下水素化ナトリウム 4. 284 gを加えた後、室温にもどして 30分攪拌した。再び反応液を氷冷し、臭化ラウリル 26. 68 gを乾燥ジメチルホルムアミド 20 m l に溶解した溶液を少量ずつ加えた。さらに室温で一夜攪拌した。反応液を氷水に注いで酢酸エチルで 3回抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、15-メトキシメトキシー13-ペンタデシン12. 374 gを得た。

· IR (cm⁻¹) : 2940, 2850, 1470, 1150, 1005, 1400, 1000, 930 · IH - NMR (CDCl₃) δ :

- 0.879 (3H, t. J=6.74Hz. CH_2CH_3), 1.257 (20H. br.s. $CH_2 \times 10$),
- 2.213 (2H, tt. J=6.96. 2.20Hz. $C \equiv C-CH_2CH_2$).
- 3.380 (3H, s. OCH_3), 4.204 (2H, t. J=2.20Hz, $OCH_2C\equiv C$).
- 4.711 (2H, s. 0CH₂0)
- (2) 上記(1)の化合物 1 2. 3 7 4 gを 1 N塩酸のメタノール液 2 3 0 m ℓ に溶解 し、6 5 ℃で 1. 5 時間加熱した。反応液を減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、2 ペンタデシニルアルコール 8. 4 6 5 gを得た。

融点=41.5~42.5℃

IR (cm⁻¹): 3300, 3200, 2960, 2930, 2850, 1480, 1030

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

- 0.880 (3H, t. J=6.47Hz, CH_3), 1.260 (20H, br.s, $CH_2 \times 10$),
- 2. 209 (2H, tt, J=6.96Hz, 2.12Hz, $C = CCH_2$).
- 4.255 (2H, dd, J=2.69, 2.44Hz, OCH₂)
- (3) 塩化カルシウム管を装着した反応容器中で、上記(2)の化合物 8. 465gをジクロロメタン $85m\ell$ に溶解し、氷冷下四臭化炭素 15.683gとトリフェニルホスフィン 14.867gを加え、0 $\mathbb C$ $\mathbb C$

 $IR (cm^{-1})$: 2930, 2850, 1470, 1420

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

- 0.880 (3H, t, J=6.43Hz, CH₃), 1.261 (20H, br.s, CH₂ \times 10),
- 2. 232 (2H. tt. J=6. 96Hz. 2. 36Hz. $C \equiv C CH_2$).
- 3. 932 (2H, t. J=2. 32Hz, $BrCH_2C \equiv C$)
- (4) アセトアミドマロン酸ジエチル3. 327gとナトリウムエチラート1. 1

37gを乾燥エタノール50m ℓ に溶解し、窒素雰囲気下、室温で30分攪拌した。乾燥エタノール30m ℓ に上記(3)の化合物4.000gを溶解した溶液を加え、15時間還流した。反応混合物にメタノール50m ℓ を加え、不溶物を除去した後、減圧下に溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-7セトアミドー2-(2-ペンタデシニル)マロン酸ジエチル3.236gを得た。

融点=43.0~43.5℃

IR (cm⁻¹): 3250, 2920, 2850, 1750, 1650, 1540, 1470, 1380, 1300, 1240, 1200, 1100, 1080, 1060, 1020, 865

$^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

- 0.879 (3H. t. J=6.35Hz, CH₃), 1.261 (20H, s. $CH_2 \times 10$),
- 1.261 (6H, t, J=7.21Hz, OCH_2CH_3), 2.057 (3H, s, Ac),
- 2.123 2.077 (2H, m, $C \equiv CCH_2CH_2$),
- 3.211 (2H, t, J=2.32Hz, $CCH_2-C \equiv C$),
- 4.253 (2H, q, J=7.08Hz, OCH₂CH₃).
- 4.257 (2H, q, J=7.08Hz, OCH₂CH₃), 6.896 (1H, br.s, NH)
- (5) 塩化カルシウム管を装着した反応容器に2-アセトアミド-2-(2-ペンタデシニル)マロン酸ジエチル2.437gを乾燥テトラヒドロフラン80mℓに溶解し、氷冷下、水素化アルミニウムリチウム0.898gを加えた後、室温にもどして30分攪拌した。氷冷下、水3mℓを加え、反応を停止し、減圧下に溶媒を留去した。残渣にピリジン70mℓ、無水酢酸130mℓを加え、室温で一夜攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出し、酢酸エチル層を1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーおよびヘキサンから再結晶して精製し、2-アセトアミドー1、3-ジアセトキシ-2-(2-ペンタデシニル)プロパン808mgを得た。融点=95.5~96.5℃

 $IR(cm^{-1})$: 3300, 2930, 2850, 1740, 1650, 1580, 1400, 1380, 1260,

1040

 ${}^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

- 0.879 (3H, t, J=6.47Hz, CH₃), 1.255 (24H, br.s, CH₂ \times 12).
- 1.980 (3H, s. NAc). 2.089 (6H, s. $0Ac \times 2$).
- 2.140 (2H. m. $CH_2C \equiv C CH_2CH_2$).
- 2.790 (2H, t. J=2.32Hz. $CH_2C \equiv C-CH_2CH_2$).
- 4.422 (4H, s, $CH_2O \times 2$), 5.829 (1H, br.s, NH)
- 実施例38:2-アミノ-2-(12-ヒドロキシドデシル)-1,3-プロパンジオール塩酸塩
- IR (KBr): 3350. 2920, 2850. 1500. 1470. 1080. 1050. 1040 cm ⁻¹ 融点= 1 3 8. 0 ~ 1 4 2. 0 ℃
 - 本化合物は次の(1)~(5)の工程により製造される。
- (1) ドデカンジオール 2 3. 0 0 0 gを乾燥テトラヒドロフラン 2 3 0 m ℓ およびジクロロメタン 4 0 m ℓ に溶解し、 $p-トルエンスルホン酸 1 0 m g およびジヒドロピラン 9. 5 7 8 g を加えた後、室温で一日攪拌した。トリエチルアミン 1. 0 m <math>\ell$ を加えて反応を停止し、反応混合物を減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ドデカンジオールモノテトラヒドロピラニルエーテル 8. 1 3 2 g を得た。
 - IR (cm⁻¹): 3620, 3450, 2930, 2850, 1460, 1360, 1140, 1125, 1080, 1030
- (2) 上記ドデカンジオールモノテトラヒドロピラニルエーテル7.882gと四

臭化炭素 1 1. 4 3 7 gをジクロロメタン 7 8 m ℓ に溶解し、氷冷下トリフェニルホスフィン 1 0. 8 4 3 gを加えて 0 ℃で 5 分攪拌した。減圧下に溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、1 - ブロモー 1 2 - テトラヒドロピラニルオキシドデカンを 4. 0 2 9 g得た。

IR (cm⁻¹): 2930, 2850, 1460, 1445, 1360, 1140, 1120, 1080, 1020, 980

$^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

- 1.274 (16H, br.s), 1.611 1.554 (6H, m), 1.750 1.689 (1H, m),
- 1.888 1.802 (1H. m), 1.852 (2H. qui, J=7.1Hz),
- 3.381 (1H, dt, J=9.5, 6.9Hz). 3.407 (2H, t, J=6.9Hz).
- 3.526 3.472 (1H, m), 3.728 (1H, dt, J=9.5, 7.0Hz),
- 3.900 3.845 (1H, m), 4.574 (1H, dd, J=4.4, 2.7Hz)
- (3) アセトアミドマロン酸ジエチル6. 996gとナトリウムエトキシド3. 189gを乾燥エタノール130mlに溶解し、これに1ープロモー12ーテトラヒドロピラニルオキシドデカン10. 698gの乾燥エタノール200ml溶液を加えた後、8時間加熱還流した。減圧下に溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して、2ーアセトアミドー2ー(12ーテトラヒドロピラニルオキシドデシル)マロン酸ジエチル5. 837gを得た。

IR (cm⁻¹): 3450, 2930, 2850, 1740, 1680, 1500, 1380, 1285, 1020 ${}^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

- 1. 25 (6H, t, J=7.1Hz), 1. 25 (20H, br. s), 1. 61 1. 52 (6H, m),
- 1.83 1.71 (2H. m), 2.03 (3H. s), 3.87 3.35 (4H. m),
- 4. 24 (4H, q. J=7. 1Hz), 4. 58 (1H, d. d, J=4. 4, 2. 4Hz),
- 6.77 (1H. br.s)
- (4) 2-rセトアミド-2-(12-rトラヒドロピラニルオキシドデシル) マロン酸ジエチル 5. 837gをメタノール 13.0m ℓ に溶解し、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム 2.202gを徐々に加えた。水素化ナトリウムの全量を加えた後、室温で 2 時間放置した。メタノール 30m ℓ を加え、 2N 塩酸で弱酸

性とした後、減圧下に溶媒を留去した。濃縮残渣にピリジン100mℓ、無水酢酸200mℓを加え、室温で一昼夜攪拌した。反応溶液を氷水に注いで酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。濃縮残渣をメタノール100mℓに溶解し、pートルエンスルホン酸30mgを加えて室温で1時間攪拌した。トリエチルアミン0.5mℓを加え、10分攪拌した後、減圧下に濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して、2−アセトアミド−1,3−ジアセトキシ−2−(12−ヒドロキシドデシル)プロパン1.180gを得た。

融点=75.0~76.5℃

IR (cm⁻¹): 3350, 2930, 2850, 1740, 1630, 1550, 1375, 1270, 1240, 1040

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

- 1.236 (22H, br.s, $CH_2 \times 11$), 1.843 1.821 (2H, m, CH_2),
- 1.937 (3H, s. NAc), 2.056 (6H, s. $OAc \times 2$).
- 3.608 (2H, br.s, CH₂OH),
- 4. 269 (4H, d.d, J=14.0, 11. 5 Hz, $CH_2OAC \times 2$),
- 5.607 (1H. br.s. NH)
- (5) 2-rehrミド-1, 3-iyrehrシ-2-(12-e)にカンドデシル)プロパン 500 m g を y タノール 24 m ℓ に溶解し、1 N 水酸化ナトリウム水溶液 6. 0 m ℓ を加え、6 時間加熱還流した。減圧下に濃縮し、x4 タノールを留去した後、残渣を酢酸エチルで抽出し、水洗後無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下に溶媒を留去し、残渣を y タノールに溶解し、塩酸酸性とした後、再び減圧下に溶媒を濃縮留去し、残渣を真空乾燥して、x4 アミノー x6 に x6 に x7 に x8 に x9 に
 - 1.23 (22H, s. $CH_2 \times 11$), 3.49 3.40 (6H, m, $CH_2O \times 3$),
 - 5.26 (3H. br.s. $OH \times 3$)

元素分析 計算値 C;56.94, H;10.99, N;4.43, 0;16.43, Cl;11.21 分析値 C;56.73, H;10.95, N;4.32, 0;16.49, Cl:11.51

実施例39:2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-ヘキシルプロパン 融点=55~56℃

実施例 4 0:2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-オクチルプロパン 融点=79,5~82℃

実施例 4 1 : 2 - アセトアミド - 1, 3 - ジアセトキシ - 2 - デシルプロパン 融点 = 7 0 ~ 7 2 ℃

実施例 4 2 : 2 - アセトアミド-1, 3 - ジアセトキシ-2 - ドデシルプロパン 融点=75.5~76.5℃

実施例43:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-トリデシルプロパン

融点=77.0~78.0℃

実施例 4 4 : 2 - アセトアミド-1, 3 - ジアセトキシ-2 - ペンタデシルプロ パン

融点=82.0~83.0℃

実施例 4 5 : 2 - アセトアミド-1, 3 - ジアセトキシ-2 - (2 - ペンタデシ ニル)プロパン

IR (KBr): 3300, 2930, 2850, 1740, 1650, 1580, 1400, 1380, 1260, 1040 cm⁻¹

融点=95.5~96.5℃

実施例46:2-アミノー2-テトラデシルー1,3-プロパンジオール

IR (KBr): 3300, 3260, 3200, 2930, 2860, 1580, 1480, 1070, 1005 cm ⁻¹

融点=68.5~69.5℃

実施例 47:2-(N-エチルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール

IR (KBr): 3360(br), 2920, 2850, 1470, 1070 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

3,530 (2H, d, J=11,4Hz), 3,472 (2H, d, J=11,4Hz),

2.545 (2H, q, J=7.2Hz), 2.5 (2H, br.s), 1.252 (34H, m),

1.121 (3H, t, J=7.0Hz), 0.879 (3H, t, J=6.6Hz)

融点=65.0~67.0℃

実施例48:2-(N, N-ジメチルアミノ)-2-テトラデシル-1, 3-プ ロパンジオール

IR (KBr): 3530, 3050(br), 2920, 2850, 1470, 1060, 1040, 1030 cm⁻¹ 融点=51~52℃

実施例49:2-アミノー2-(4-テトラデセニル)-1, 3-プロパンジオ ール塩酸塩

本化合物は以下(1)~(6)のようにして製造される。

(1) アセトアミドマロン酸ジエチル 6. 0 gを脱水エタノール 5 0 m ℓ に溶解し、ナトリウムエトキシド 2. 2 6 gおよび 5 - プロモー 1 - ペンテン 5. 2 2 gを加え、窒素雰囲気下、一夜還流した。反応液を中和後濃縮し、さらにヘキサンー酢酸エチル (5:1→2:1)を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、無色油状物の 2 - アセトアミドー 2 - ペンテニルーマロン酸ジエチル 4 . 8 7 1 gを得た。

I R ν max (CHCl₃): 3450, 3000, 2950, 1740, 1680, 1500, 1480, 1280. 1200, 1100, 1020, 920, 860 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

1.25 (2H, m), 1.255 (6H, t, J=7.2Hz), 2.044 (2H, m),

2.040 (3H, s), 2.336 (2H, m), 4.246 (4H, q, J=7.2Hz),

4,990 (1H, dd, J=1.8, 17.2Hz), 5.013 (1H, dd, J=1.8, 10.6Hz),

5.758 (1H, ddt, J=6.2, 10.6, 17.2Hz), 6.789 (1H, s)

(2) $2-rセトアミド-2-ペンテニルマロン酸ジエチル4.0 gをアセトン2 <math>10m\ell$ に溶解し、N-メチルモルホリン-N-オキシド3.3 gおよび1%四酸化オスミウム水溶液36mℓを加え、室温で2時間攪拌した。これに亜硫酸ナ

トリウム700mg/水20mℓ溶液を加え、15分攪拌した。反応液を濃縮し、クロロホルム/メタノール(10:1)を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、R f 値:0.3(クロロホルム:メタノール=10:1)の留分を濃縮した。残渣を1,4ージオキサン630mℓに溶解し、0.2 Mメタ過ヨウ素酸ナトリウム水溶液70mℓを加え、室温で2時間攪拌した。反応液を濾別後、濃縮し、酢酸エチルで抽出し、さらに水洗した。ヘキサン層を脱水後、濃縮し、無色油状物の2-アセトアミドー2-(4-ホルミルプチル)マロン酸ジエチル4.17gを得た。

Rf値=0.4(クロロホルム: メタノール=10:1)

(3) 臭化デカン7. 0gおよびトリフェニルホスフィン10gを窒素雰囲気下1 20℃で8時間攪拌した。アセトン-エーテルにより再結晶し、無色結晶の臭化 デシルトリフェニルホスホニウム14.4gを得た。

IR ν max (CHCl₃): 2920, 2850, 1440, 1120, 1000, 680 cm⁻¹

(4) 臭化デシルトリフェニルホスホニウム 10.85 g を乾燥テトラヒドロフラン 100 m ℓ に溶解し、アルゴン雰囲気下、1.6 M n - ブチルリチウム/ヘキサン溶液 13 m ℓ を滴下し、15 分攪拌した。-78 $^{\circ}$ に冷却し、2- アセトアミド-2-(4- ホルミルブチル)マロン酸ジエチル 4.17 g $^{\circ}$ 乾燥テトラヒドロフラン 50 m ℓ 溶液を滴下し、-78 $^{\circ}$ 、アルゴン雰囲気下、40 分攪拌した。同条件下で、t- ブタノール 3.3 m ℓ $^{\circ}$ 乾燥テトラヒドロフラン 15 m ℓ 溶液を滴下し、室温、アルゴン雰囲気下、1.5 時間攪拌した。反応液をエーテルで希釈し、水洗した後、有機層を脱水後、濃縮した。さらに、ヘキサン一酢酸($5:1\rightarrow 5:2$)を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色油状物の2- アセトアミド-2-(4- テトラデセニル)マロン酸ジエチル 2.1 g を得た。

I R ν max (CHCl₃): 3450, 2940, 2850, 1740, 1680, 1500, 1380, 1280, 1200, 1100, 1020, 860 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

0.88 (3H, t, J=6.6Hz), 1.257 (16H, m), 1.255 (6H, t, J=7.08Hz),

2.010 (4H, m), 2.066 (3H, s), 2.334 (2H, m),

4.243 (4H, q, J=7.08Hz), 5.273 (1H, dt, J=5.4, 10.8Hz),

5. 376 (1H, dt, J=5. 4, 10. 8Hz), 6. 775 (1H, s)

(5) 2-rセトァミド-2-(4-rトラデセニル) マロン酸ジエチル807m gを乾燥テトラヒドロフラン25mlに溶解し、氷冷下、水素化アルミニウムリチウム297mgを加え、室温で1.5時間攪拌した。これに、水0.544mlを氷冷下に加え、室温で30分攪拌した。反応液を濃縮し、残渣にピリジンー無水酢酸適量を加え、一夜、室温で攪拌した。反応液を氷中に注加し、酢酸エチルで抽出し、1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄した。酢酸エチル層を脱水後、濃縮し、さらにヘキサン-酢酸エチル(3:1→2:1)を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、無色粉末の2-rセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(4-rトラデセニル)プロパン537mgを得た。

IR ν max (CHCl₃): 3430, 2920, 2850, 1740, 1680, 1500, 1370, 1280, 1180, 1090, 1010, 855 cm⁻¹

(6) 2-rセトアミド-1, $3-ジrセトキシ-2-(4-rトラデセニル)プロパン450mgをメタノール27m<math>\ell$ に溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液 $9m\ell$ を加え、窒素雰囲気下、8時間還流した。反応液を塩酸で中和後、濃縮し、水を加え、Sep-Pak(C_{18})(商品名)に付し、メタノールで溶出した。メタノール溶出液を濃縮し、淡黄色油状物の2-rミノ-2-(4-rトラデセニル)1. 3-プロパンジオール塩酸塩332mgを得た。

I R ν max (KBr) : 3400(br), 2920, 2850, 1590, 1500, 1470, 1050, $1040~{\rm cm}^{-1}$

R f 値: 0.6 (クロロホルム:メタノール:酢酸:水=70:20:6:4) 実施例50:2-アミノー1, 3-ジアセトキシー2-オクタデシルプロパン IR (CHCl₃): 3400(br), 2930, 2850, 1740, 1470, 1380, 1240, 1040 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

4.014 (2H, d, J=11.0Hz), 3.938 (2H, d, J=11.0Hz),

2.089 (6H, s), 1.255 (34H, m), 0.879 (3H, t, J=6.6Hz)

本化合物は次のようにして調製される。

(1) 2-rミノー1, 3-プロパンジオール塩酸塩7gをN, <math>N-ジメチルホルムアミド150mℓに懸濁し、トリエチルアミン3. 8gおよびジーt-ブチルジカーボネート5. <math>4gを加え、50℃で5時間攪拌した。氷冷下、反応液に水を加え、攪拌した後、生じた沈殿を減圧濾過により濾取した。この沈殿をヘキサンー酢酸エチル(5:1)で再結晶し、無色結晶の<math>2-オクタデシル-2-(N-t-プトキシカルボニルアミノ)-1, 3-プロパンジオール6. 7ggを得た。

I R ν max (KBr) : 3400(br), 3300, 2920, 2850, 1680, 1560, 1300, 1180, 1020 cm⁻¹

I R ν max (CHCl₃): 3460, 2930, 2850, 1740, 1690(sh), 1510, 1470, 1380, 1240, 1160, 1040 cm⁻¹

(3) 上記(2)の化合物 4.8 gをトリフルオロ酢酸 $10 \, \mathrm{m} \, \ell$ に溶解し、室温で $15 \, \mathrm{fm} \, \ell$ に溶解し、室温で $15 \, \mathrm{fm} \, \ell$ に溶解し、空温で $15 \, \mathrm{fm} \, \ell$ に溶解し、空温で $15 \, \mathrm{fm} \, \ell$ に溶解し、これを酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウムにより洗浄した。酢酸エチル層を脱水後、濃縮し、無色油状物の $2 - \mathrm{res} \, \ell - 1$, $3 - \mathrm{i} \, \ell \, \ell$ アミノー 1, $3 - \mathrm{i} \, \ell \, \ell$ アミノー 1, $3 - \mathrm{i} \, \ell \, \ell$ アセトキシー $2 - \mathrm{i} \, \ell \, \ell$ クデシルプロパン $3 - \mathrm{i} \, \ell \, \ell$ を得た。

実施例 5 1 : 1, 3 - ジアセトキシー 2 - オクタデシルー 2 - (N - ペンタノイルアミノ) プロパン

IR (CHCl₃): 3450, 3400, 2920, 2850, 1740, 1680, 1520, 1460, 1380, 1240, 1020 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

- 5.599 (1H, s), 4.330 (2H, d, J=11.6Hz), 4.271 (2H, d, J=11.6Hz),
- 2.150 (2H, t, J=7.2Hz), 2.078 (6H, s), 1.6 (4H, m).
- 1.251 (34H, m), 0.918 (3H, t, J=7.4Hz), 0.879 (3H, t, J=6.8Hz)
- 実施例 $5 \ 2 : 2 オクタデシル 2 (N ペンタノイルアミノ) 1, 3 プロパンジオール$

I R (KBr): 3420, 3350(br), 2920, 2850, 1650, 1520, 1460, 1030 cm⁻¹ 1 H - NMR (CDCl₃ /TMS) δ :

- 5.840 (1H, s), 4.021 (2H, br.s), 3.803 (2H, d, J=11.4Hz),
- 3.559 (2H. t. J=11.4Hz), 2.231 (2H. t. J=7.8Hz), 1.6 (4H. m).
- 1.251 (34H, m), 0.928 (3H, t, J=7.4Hz), 0.878 (3H, t, J=6.6Hz)

融点=73.0~73.5℃

上記化合物は、次のようにして製造される。

(1) $2-r \ge J-1$, $3-i \ge r + i \ge -2-i + j \ge r \ge J-1$, $0 \le e \le j \le J-1$, $0 \le i \le J-1$, $0 \le i \le J-1$, $0 \le j \le J-1$, $0 \le J-1$,

I R ν max (CHCl₃): 3450, 3400, 2920, 2850, 1740, 1680, 1520, 1460, 1380, 1240, 1020 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

- 0.879 (3H, t, J=6.8Hz), 0.918 (3H, t, J=7.4Hz), 1.251 (34H, m).
- 1.6 (4H, m), 2.078 (6H, s), 2.150 (2H, t, J=7.2Hz),
- 4.271 (2H, d, J=11.6Hz), 4.330 (2H, d, J=11.6Hz), 5.599 (1H, s)
- (2) 1, 3-ジアセトキシー2-オクタデシルー2-(N-ペンタイルアミノ)

実施例 5 3 : 2 - オクタデシル - 2 - (N - ペンチルアミノ) - 1, 3 - プロパ ンジオール

IR (KBr): 3470(br), 2930, 2850, 1480, 1060 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

- 3.990 (3H. br.s), 3.707 (2H, d, J=12.8Hz),
- 3.643 (2H, d, J=12.8Hz), 2.686 (2H, t, J=7.8Hz), 1.252 (40H, m).
- 0.908 (3H, t, J=7.0Hz), 0.879 (3H, t, J=6.6Hz)

融点=53.0~54.0℃

本化合物は次のようにして製造される。

1、 $3-\Im r$ セトキシー $2-\mathop{x} 2$ クタデシルー $2-(N-\mathcal{N})$ クノイルアミノ)プロパン400mgを乾燥エーテル30m ℓ に溶解し、氷冷下、水素化アルミニウムリチウム150mgを加え、室温で3時間攪拌した。反応液を濃縮し、乾燥テトラヒドロフラン20m ℓ を加え、氷冷下、水0.15m ℓ 、15%水酸化ナトリウム水溶液0.15m ℓ 、水0.45m ℓ を順次加えた後、反応液を濾過した。滤液を濃縮し、クロロホルムーメタノールー酢酸($19:1:0.1\rightarrow 10:1:0.05$)を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色粉末の $2-\mathop{x} 2$ クタデシルー $2-(N-\mathcal{N})$ プロパンジオール153mgを得た。

実施例 5 4 : 2 - (N-デカノイルアミノ) - 1, 3 - ジアセトキシ-2 - オクタデシルプロパン

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

5.594 (1H, s), 4.828 (2H, d, J=12.0Hz), 4.269 (2H, d, J=12.0Hz),

2.140 (2H, t, J=7.2Hz), 1.6 (2H, m), 1.252 (46H, m),

0.878 (6H, t, J=6.8Hz)

R f 值: 0.5 (EtOAc: C₆ H ₁₄ = 1:2)

実施例 5 5 : 2 - (N-デカノイルアミノ) - 2 - オクタデシル-1, 3 - プロ パンジオール

IR (KBr): 3350, 3100, 2920, 2850, 1640, 1560, 1480, 1080 cm⁻¹

融点=71.5~72.5℃

実施例 5 6 : 2 - (N-デシルアミノ) - 2 - オクタデシル- 1, 3 - プロパン ジオール

IR (KBr): 3350(br), 2920, 2850, 1470, 1060 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

3.562 (2H, d, J=12.8Hz), 3.498 (2H, d, J=12.8Hz),

2.741 (3H. br.s), 2.536 (2H. t. J=7.2Hz), 1.525 (2H. m).

1.251 (48H, m), 0.879 (6H, t, J=6.8Hz)

融点=48.0~49.5℃

実施例 5 7 : 1, 3 - ジアセトキシー 2 - (N, N - ジメチルアミノ) - 2 - オ クタデシルプロパン

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

4. 208 (2H, d, J=11. 4Hz), 4. 071 (2H, d, J=11. 4Hz), 2. 359 (6H, s),

2.070 (6H, s), 1.252 (34H, m), 0.878 (3H, t, J=6.8Hz)

R f 值: 0.4 (EtOAc: C6 H 14 = 3:2)

実施例 5 8 : 2 - (N, N-ジメチルアミノ) - 2 - オクタデシル-1, 3 - プロパンジオール

IR (KBr): 3540, 3100(br), 2920, 2850, 1470, 1060, 1040 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

3.715 (2H, d, J=10.8Hz), 3.632 (2H, d, J=10.8Hz).

3.040 (2H, br.s), 2.412 (6H, s), 1.253 (34H, m),

0.880 (3H, t. J=6.8Hz)

・・融点=63.5~64.5℃ 本化合物は次のようにして製造される。

(1) $2-r \ge J-1$, $3-i \ge r + i \ge -2-i + 2 = 2 - i \ge 2 - i \ge$

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

0.878 (3H, t, J=6.8Hz), 1.252 (34H, m), 2.070 (6H, s),

2.359 (6H, s). 4.071 (2H, d, J=11.4Hz), 4.208 (2H, d, J=11.4Hz) R f 値= 0. 4 (酢酸エチル:ヘキサン= 3:2)

(2) 上記(1)の化合物 $4 \ 3 \ 6 \ m \ g \ e^{\chi} \ g \ J - \nu 1 \ 5 \ m \ \ell$ に溶解し、 $2 \ 8 \ \% + \Gamma$ リウムメトキシドメタノール溶液 $3 \ 7 \ m \ g \ e$ 加え、室温で $6 \ F \ ll$ 攪拌した。反応液を濃縮した後、水を加え、生じた沈殿を濾取し、さらに、クロロホルムーヘキサンにより再結晶し、無色結晶の $2 \ - (N, N \ - \ i \ j \ + \nu) \ - 2 \ - \chi / 2 \ f \ r$ ルー $1 \ - \chi / 2 \ - \chi / 2 \ + \nu / 2 \ + \nu$

実施例 6 0 : 2 - アミノー 2 - (3 - ドデシルチオプロピル) - 1, 3 - プロパンジオール塩酸塩

I R (KBr): 3510, 3450, 3380, 3020, 2920, 2850, 1630, 1530, 1460, 1070, 1050 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ -DMSOd₆ /TMS) δ :

3.78 (2H, d, J=11.8Hz), 3.68 (2H, d, J=11.8Hz), 2.5 (4H, m),

1.26 (24H, m), 0.88 (3H, t, J=7.1Hz)

融点=76~78℃

· 本化合物は以下のようにして製造される。

IR ν max (CHCl₃): 3450(br), 2930, 2850, 1460, 1050 cm⁻¹

(2) 3ードデシルチオプロパノール3.0gをジクロロメタン60mℓに溶解し、 氷冷下、四臭化炭素7.66g、トリフェニルホスフィン5.44gを加え、氷 冷下、15分攪拌した。反応液を濃縮し、残渣をヘキサンで抽出後、その抽出液 を濃縮した。さらに、ヘキサンを展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、淡黄色油状物の3ープロモプロピルドデシルスルフィド3. 255gを得た。

R f 値= 0. 4 (ヘキサン)

(3) アセトアミドマロン酸ジエチル1. 6 gを脱水エタノール30mℓに溶解し、ナトリウムエトキシド505mgおよび3-プロモプロピルドデシルスルフィド2 gを加え、窒素雰囲気下、一夜還流した。反応液を濃塩酸-エタノール(1:11)で中和後、濃縮した。さらに、ヘキサン-酢酸エチル(5:1→5:2)を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色粉末の2-セトアミド-2-(3-ドデシルチオプロピル)マロン酸ジエチル1. 722 gを得た。

I R ν max (CHCl₃) : 3440, 2930, 2850, 1740, 1680, 1500, 1380, 1260, 1100, 1020, 860 cm⁻¹

 $^{1}H - NMR (CDCl_{3}/TMS)\delta$:

0.88 (3H. t. J=7.4Hz), 1.26 (18H. m), 1.26 (6H, t, J=7.3Hz).

1.57 (4H, m), 2.04 (3H, s), 2.42 (2H, m), 2.47 (2H, t, J=7.3Hz),

2. 48 (2H, t, J=7. 3Hz), 4. 25 (4H, q, J=7. 4Hz), 6. 78 (1H, s)

(4) 2-rv+r=1-2-(3-r) のrv+r=1 の rv+r=1 の rv+r=

 $^{1}H - NMR (CDCl_{2}/TMS) \delta$:

0.88 (3H, t. J=6.8Hz), 1.26 (24H, m), 1.96 (3H, s),

2.09 (6H, s), 2.5 (4H, m), 4.30 (4H, s), 5.67 (1H, s)

R f 値= 0. 4 (酢酸エチル: ヘキサン= 7:3)

(5) 2-rehrミド-1, 3-ijrehr+ij-2-(3-ijrij)ルチオプロピル)プロパン 750mgをメタノール 30m ℓ に溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液 10m ℓ を加え、窒素雰囲気下、6 時間選流した。反応液を氷冷し、生じた沈殿を濾取した。沈殿をメタノールに溶解し、濃塩酸-メタノール(1:11) 3m ℓ を加え、濃縮した。さらに、酢酸エチルーヘキサンにて再結晶し、無色結晶の 2-rミノー 2-(3-ijrij)ル上では、3-ijrij の 3-ijrij の

実施例 6 1 : 2 - アセトアミド-1, 3 - ジアセトキシ-2 - (3 - ドデシルチオプロピル) プロパン

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃ /TMS) δ :

5.67 (1H, s), 4.30 (4H, s), 2.5 (4H, m), 2.09 (6H, s),

1.96 (3H, s), 1.26 (24H, m), 0.88 (3H, t, J=6.8Hz)

Rf值: 0.4 (EtOAc: C₆ H₁₄ = 7:3)

- 実施例 6 2 : 2 アミノー 2 (3, 7, 11 トリメチルドデシル) 1, 3 プロパンジオール塩酸塩
- 実施例 6 3 : 2 アミノー 2 (3, 7, 11 トリメチルー 2, 6, 10 トリデセニル) 1, 3 プロパンジオール塩酸塩
- 実施例64:2-アミノ-2-(8-オキソテトラデシル)-1,3-プロパンジオール塩酸塩
- 実施例 6 5 : 2 アミノー 2 (8 ヒドロキシテトラデシル) 1, 3 プロパンジオール塩酸塩
- 実施例 6 6 : 2 アミノー 2 (2 ドデシルアミノエチル) 1, 3 プロパンジオール塩酸塩
- 実施例67:2-アミノー2-(2-ドデカノイルアミノエチル)-1,3-プロパンジオール塩酸塩
- 実施例68:2-アミノー2-(11-カルボキシウンデシル)-1,3-プロパンジオール塩酸塩
- 実施例 69:2 アミノー 2-(11- y + 2) カルボニルウンデシル) -1, 3-プロパンジオール塩酸塩
- 実施例 7 0 : 2 アミノー 2 (1 2 アセトキシドデシル) 1, 3 プロパンジオール塩酸塩
- 実施例 7 1 : 2 アセトアミド-1, 3 ジアセトキシ-2 (3, 7, 11-トリメチルドデシル) プロパン
- 実施例 7 2 : 2 アセトアミド-1, 3 ジアセトキシ-2 (3, 7, 1 1 トリメチル-2, 6, 1 0 トリデセニル) プロパン
- 実施例 7 3 : 2 アセトアミド 1, 3 ジアセトキシ 2 (8 オキソテト ラデシル) プロパン
- 実施例 7 4 : 2 アセトアミド-1, 3 ジアセトキシ-2 (8 ヒドロキシ テトラデシル)プロパン

実施例75:2-アセトアミドー1,3-ジアセトキシー2-(11-メトキシカルボニルウンデシル)プロパン

実施例76:2-アミノー2-(2-プロピニル)-1、3-プロパンジオール

実施例77:2-rミノー2-(2-r)ロペニル)-1, 3-rロパンジオール

実施例 78:2-(N-メチルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール

実施例 7 9: 2 - (N, N-ジメチルアミノ) - 2 - オクタデシル-1, 3 - プロパンジオール

実施例 80:2-(N-オクタデシルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール

実施例 8 1 : 2 - (N, N-ジオクタデシルアミノ) - 2 - オクタデシル-1, 3 - プロパンジオール

実施例 82:2-(N-オクタデカノイルアミノ)-2-オクタデシル-1,3

実施例83:2-アミノ-2-デシル-1,3-プロパンジオール

実施例84:2-アミノ-2-ドデシル-1, 3-プロパンジオール

実施例85:2-アセトアミド-2-オクタデシル-1,3-プロパンジオール

実施例 8 6 : 2 - アミノ - 2 - (2 - オクタデシニル) - 1, 3 - プロパンジオ ール

実施例 8 7 : 2 - アミノー 2 - (2 - オクタデセニル) - 1, 3 - プロパンジオール

実施例88:2-アミノ-2-(4-フェニルプチル)-1, 3-プロパンジオ ール

実施例 8 9 : 2 - アミノー 2 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 3 - プロパンジ オール

実施例 9 0 : 2 - アミノ - 2 - (2 - フェニルプロピル) - 1, 3 - プロパンジ オール

実施例91:2-アミノー2-[8-(4-ヘキシルフェニル)オクチル]-1,

3-プロパンジオール

実施例 9 2 : 2 - アミノ - 2 - [4 - (4 - デシルフェニル) プチル] - 1, 3 - プロパンジオール

実施例 9 3 : 2 - アミノ - 2 - [4 - (4 - ペンチルオキシフェニル) ブチル] - 1, 3 - プロパンジオール

実施例 9 4 : 2 - アミノー 2 - [4 - (4 - プロモフェニル) プチル] - 1, 3 - プロパンジオール

実施例 9 5 : 2 - アミノ - 2 - [3 - (2, 4 - ジニトロフェニル) プロピル] - 1, 3 - プロパンジオール

実施例 9 6 : 2-アミノー 2- [3- (4-アミノフェニル) プロピル] -1, 3-プロパンジオール

実施例 9.7:2-rミノー 2-[3-(4-r)) ルオキシフェニル) -2-rロペニル] -1, 3-rロパンジオール

実施例98:2-アミノ-2-(14-フルオロテトラデシル)-1,3-プロ パンジオール・塩酸塩、融点=92~94℃

実施例99:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(14-フルオロ テトラデシル)プロパン、融点=82~84℃

実施例100:2-アミノ-2-(9-ペンチルオキシノニル)-1, 3-プロ パンジオール・1/5水和物、融点=32~33℃

実施例 $1 \ 0 \ 1 : 2 - r \ v + r \ v = 1$, $3 - \Im r \ v + 2 - 2 - (9 - \mathcal{C} v + v)$ オキシノニル) プロパン、融点 $= 6 \ 2 \sim 6 \ 4 \ \mathcal{C}$

実施例102:2-アミノ-2-(8-ヘキシルオキシオクチル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=66~67℃

実施例 $1 \ 0 \ 3 : 2 - アセトアミド-1$, $3 - ジアセトキシ-2 - (8 - ヘキシル オキシオクチル) プロパン、融点=<math>6 \ 6 \sim 6 \ 9 \, \%$

実施例 1 0 4 : 2 - アミノー 2 - (7 - ヘプチルオキシヘプチル) - 1, 3 - プロパンジオール・塩酸塩、融点=59~61℃

実施例105:2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(7-ヘプチル

オキシヘプチル)プロパン、融点=53~55°C

- 実施例 1 0 6 : 2 アミノー 2 (6 オクチルオキシヘキシル) 1, 3 プロパンジオール・塩酸塩、融点=58~62℃
- 実施例 $1\ 0\ 7: 2- 7セトアミド-1$, $3- ジアセトキシ-2-(6- オクチル オキシヘキシル) プロパン、融点=<math>4\ 7\sim 5\ 0$ $^{\circ}$
- 実施例108:2-アミノ-2-(2-フェニルエチル)-1, 3-プロパンジ オール・塩酸塩、融点=156~157℃
- 実施例 $1 \ 0 \ 9 : 2 アセトアミド-1$, $3 ジアセトキシ-2 (2 フェニル エチル) プロパン、融点=<math>1 \ 1 \ 6 \sim 1 \ 1 \ 7$ \mathbb{C}
- 実施例110:2-アミノ-2-(3-フェニルブチル)-1, 3-プロパンジ オール・塩酸塩・1/5水和物、融点=111~118℃
- 実施例111:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(3-フェニル ブチル)プロパン、融点=98~99℃
- 実施例 1 1 2 : 2 アミノー 2 (6 フェニルヘキシル) 1, 3 プロパンジオール、融点= 7 7 ~ 7 9 ℃
- 実施例113:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(6-フェニル ヘキシル)プロパン、融点=58~59℃
- 実施例114:2-アミノー2-(10-フェニルデシル)-1, 3-プロパン ジオール、融点=87~88.5℃
- 実施例115:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(10-フェニルデシル)プロパン、IR;3301,2928,2855,1747,1661,1552cm⁻¹
- 実施例116:2-アミノ-2-(6-(3-フェニルプロピルオキシ) ヘキシル)-1,3-プロパンジオール・1/4水和物、融点=66~67℃
- 実施例117:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[6-(3-フェールプロピルオキシ)へキシル)プロパン、IR;3418,1735,1655,1026cm⁻¹

·実施例118:2-アミノ-2-〔8-(フェニルメチルオキシ)オクチル〕-1,3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=87~88℃

- 実施例119:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[8-(フェニルメチルオキシ)オクチル]プロパン、IR;3308,1740,1660,1240cm⁻¹
- 実施例 $1\ 2\ 1\ :\ 2\ -\ 7\ +$
- 実施例122:2-アミノー2-〔4-(4-ブチルシクロヘキシル)ブチル〕 -1,3-プロパンジオール・塩酸塩・1/5水和物、融点=9 6~99℃
- 実施例 $1\ 2\ 3\ :\ 2\ -\ 7\ +\$
- 実施例124:2-アミノー2-(4-ノニルフェニルメチル)-1, 3-プロ パンジオール、融点=112~113℃
- 実施例125:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(4-ノニルフェニルメチル)プロパン、融点=85~89℃
- 実施例126:2-アミノ-2-〔3-(4-ヘプチルフェニル)プロピル〕-1,3-プロパンジオール・1/2水和物、融点=78~80℃
- 実施例 $1\ 2\ 7\ :\ 2\ -\ 7\ t\ +\ 7\ t\$
- 実施例128:2-アミノ-2-〔3-(4-ウンデシルフェニル) プロピル〕 -1,3-プロパンジオール、融点=89~91℃
- 実施例129:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔3- (4-ウンデシルフェニル)プロピル〕プロパン、融点=64~67℃
- 実施例130:2-アミノ-2-[4-(4-オクチルフェニル) ブチル]-1,

3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=108~110℃

- 実施例 $1\ 3\ 1\ :\ 2\ -\ 7\ +\$
- 実施例132:2-7ミノ-2-(6-(4-プチルフェニル) ヘキシル) -1, $3-プロパンジオール、融点=<math>70\sim71$ $\mathbb C$
- 実施例133:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[6-(4-プ チルフェニル)へキシル]プロパン、IR;3300,2930, 2858,1748,1660cm⁻¹
- 実施例134:2-アミノ-2-〔8-(4-エチルフェニル)オクチル〕-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩・1水和物、融点=47~48℃
- 実施例135:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[8-(4-エ チルフェニル)オクチル)プロパン、融点=58~60℃
- 実施例 $1\ 3\ 6: 2-$ アミノ $-\ 2-$ (4-オクチルオキシフェニルメチル) $-\ 1$,3-プロパンジオール、融点 $=\ 1\ 1\ 9\sim 1\ 2\ 0$ $^{\circ}$
- 実施例137:2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(4-オクチル オキシフェニルメチル)プロパン、融点 $=77\sim78$ $^{\circ}$
- 実施例138:2-アミノ-2-(4-デシルオキシフェニルメチル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点 $=100\sim102$ °C
- 実施例139:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(4-デシルオキシフェニルメチル)プロパン、融点 $=74\sim77$ ^{\circ}
- 実施例140:2-アミノ-2-〔2-(4-ペンチルオキシフェニル)エチル〕 -1,3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=134~137℃
- 実施例141:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[2-(4-ペンチルオキシフェニル)エチル]プロパン、融点=93~95℃
- 実施例142:2-rミノー2-(3-(4-n+2)) プロピル 3-7 アンジオール、融点1,3-7 アンジオール、融点1,3-7 アンジオール、
- 実施例143:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[3-(4-ヘ キシルオキシフェニル)プロピル]プロパン、融点=70~72.

5 °C

- 実施例 1 4 4 : 2 r \ge 1 -
- 実施例 $1 \ 4 \ 5 : 2 アセトアミド-2 (3 (4 へプチルオキシフェニル)$ プロピル) -1, $3 プロパンジオール、融点= <math>9 \ 3 \sim 9 \ 5 \ \mathbb{C}$
- 実施例 $1 \ 4 \ 6 : 2 7 \ge J 2 (3 (4 オクチルオキシフェニル) プロピル) 1, 3 プロパンジオール、融点= <math>7 \ 3 \sim 7 \ 5 \ C$
- 実施例147:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔3-(4-オ クチルオキシフェニル)プロピル〕プロパン、融点=66~69 ℃
- 実施例 $1 \ 4 \ 8 : 2 7 \le J 2 (4 (4 デシルオキシフェニル) プロピル)$ - 1, $3 - プロパンジオール、融点= 6 0 \sim 6 2 ^{\circ}$
- 実施例149:2-アセトアミドー1, 3-ジアセトキシー2-[4-(4-デ シルオキシフェニル)プロピル]プロパン、融点= $66\sim67$ ℃
- 実施例 150:2-r ミノー 2-(3-(3-n) チルオキシフェニル)プロピル]-1 、3-プロパンジオール・塩酸塩、融点 =102-10 3 $^{\circ}$ C
- 実施例151:2-アセトアミド-2-〔3-(3-ヘプチルオキシフェニル) プロピル〕-1,3-プロパンジオール、IR;3305,29 32,1652,1376cm⁻¹
- 実施例 152:2-アミノ-2-[4-(4-ペンチルオキシフェニル) プチル]- 1、3-プロパンジオール、融点= $79\sim80$ $^{\circ}$
- 実施例153:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔4-(4-ペ ンチルオキシフェニル)ブチル〕プロパン、融点=83~84℃
- 実施例155:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔4-(4-へ

キシルオキシフェニル)ブチル]プロパン、融点=83~87℃

- 実施例 1 5 6 : 2 アミノ 2 〔5 (4 プトキシフェニル) ペンチル) 1, 3 プロパンジオール・塩酸塩、融点= 7 9 ~ 8 0 ℃
- 実施例157:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔5-(4-ブ トキシフェニル)ペンチル〕プロパン、融点=71~73℃
- 実施例158:2-アミノ-2-〔8-(4-メトキシフェニル)オクチル〕-1,3-プロパンジオール、融点=69~70℃
- 実施例159:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[8-(4-メトキシフェニル)オクチル)プロパン、IR;3301,174 5,1662,1246cm⁻¹
- 実施例160:2-7ミノー2-(4-(4-2)-2) で 3-2 で 3
- 実施例161:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔4-(4-ク ロロフェニル)プチル〕プロパン、融点=82~84℃
- 実施例 1 6 2 : 2-rミノー2-(3-(4-r))プロピル) -1, 3-rロパンジオール・1/4水和物、融点=1 1 $2\sim1$ 1 3 $\mathbb C$
- 実施例 $1 \ 6 \ 3 : 2 t プトキシカルボニルアミノ <math>- 2 (3 (4 デカノ イ$ ルアミノフェニル) プロピル] プロパン、融点 $= 9 \ 3 \sim 9 \ 4 \ \mathbb{C}$
- 実施例164:2-アミノ-2-〔3-(4-デシルアミノフェニル) プロピル) -1,3-プロパンジオール・1/2水和物、融点=100~ 102℃
- 実施例165:2-アミノ-2-{7-(2-(4-ヘキシルフェニル)-1, 3-ジオキソラン-2-イル)ヘプチル}-1,3-プロパンジオール・1/2水和物・塩酸塩、IR;3346,1610,1 510,1047cm⁻¹
- 実施例166:2-アセトアミドー1, 3-ジアセトキシー2- $\{7 \{2 \{4-$ (2-

プチル} プロパン、IR; 3308, 1745, 1660, 12 38, 1043cm⁻¹

- 実施例167:2-アミノー2-(7-(4-ヘキシルベンゾイル) ヘプチル) -1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=114~115 $\mathbb C$
- 実施例168:2-アミノ-2-〔8-(4-ヘキシルフェニル)オクチル〕-1,3-プロパンジオール、融点=71~73℃
- 実施例169:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[8-(4-ヘキシルフェニル)オクチル]プロパン、IR:3306,1745,1660,1240cm⁻¹
- 実施例170:2-アミノ-2-{3-(4-(2-デシル-1, 3-ジオキソ ラン-2-イル)フェニル)プロピル}-1, 3-プロパンジオ ール・2/3水和物、IR;3346,1037cm⁻¹
- 実施例 $1\ 7\ 1: 2-r$ セトアミドー1, 3-ジアセトキシー2- $\{3 \{4-$ (2-デシル-1, 3-ジオキソラン-2-イル) フェニル] プロピル} プロパン、融点 $=4\ 5\sim4\ 7^{\circ}$ C
- 実施例172:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-{3-(4-(2-ヘキシル-1,3-ジオキソラン-2-イル)フェニル)プ ロピル}プロパン・3/5水和物、融点=48~50℃
- 実施例173:2-アミノ-2-〔3-(4-デカノイルフェニル)プロピル〕 -1,3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=126~127℃
- 実施例174:2-アミノ-2-〔3-(4-ヘプタノイルフェニル) プロピル〕 -1,3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=129~130℃
- 実施例175:2-アミノ-2-{2-(4-(5-フェニルペンチルオキシメ チル)フェニル]エチル}-1,3-プロパンジオール・塩酸塩・ 3/2水和物、融点=105~108℃
- 実施例176:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-{2-(4-(5-フェニルペンチルオキシメチル)フェニル]エチル}プロパン、IR;3308,1738,1651,1226cm⁻¹

- 実施例178:2-アセトアミドー2-〔6-(4-ヘキシルオキシフェニルオキシ) ヘキシル〕-1, 3-プロパンジオール、融点 $=81\sim8$ 3 $^{\circ}$
- 実施例179:2-rミノ-2-(6-(2-7)ェニルオキシエチルオキシ)へキシル)-1, 3-7ロパンジオール、融点 $=90\sim93$ $\mathbb C$
- 実施例180:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[6-(2-フェニルオキシエチルオキシ)へキシル]プロパン、IR;2935,2864,1744,1660,1245cm⁻¹
- 実施例182:2-アミノ-2-(12-フェニルオキシドデシル)-1,3-プロパンジオール・塩酸塩
- 実施例183:2-(N,N-ジメチルアミノ)-2-(2-(4-オクチルフェニル)エチル)-1,3-プロパンジオール
- 実施例184:2-アミノー2-(2-(4-ヘキシルオキシフェニル) エチル) -1, 3-プロパンジオール
- 実施例185:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[2-(4-ヘ キシルオキシフェニル)エチル]プロパン
- 実施例186:2-アミノ-2-{2-〔4-(8-フルオロオクチル)フェニル〕エチル}-1,3-プロパンジオール
- 実施例187:2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2- $\{2 \{4-$ (8-フルオロオクチル) フェニル $\}$ エチル $\}$ プロパン
- 実施例188:2-アミノ-2-{2-[4-(7-フルオロヘプチルオキシ) フェニル] エチル} -1, 3-プロパンジオール

白色アモルファス様固体

・Rf値=0.09(クロロホルム:メタノール=9:1) $^{1}H-NMR$ (DMSO-d₆) δ ;

1. 26-1. 64 (14H, m), 3. 50 (4H, s), 3. 90 (2H, t, J=6. 3Hz), 4. 42 (2H, td, J=47. 4Hz, 6. 3Hz), 5. 48 (2H, br. s), 6. 83 (2H, d, J=8. 8Hz), 7. 09 (2H, d, J=8. 8Hz), 7. 86 (3H, br. s)

IR (KBr) 3391, 1612, 1581, 1249, 831 cm⁻¹

元素分析 計算値: C=56.61. H=8.71. N=3.67 分析値: C=57.00. H=8.58. N=3.69

;

実施例189:2-アセトアミドー1, 3-ジアセトキシー2- $\{2 \{4-$ (7-フルオロヘプチルオキシ) フェニル $\}$ エチル $\}$ プロパン

無色液体、Rf値=0.70(酢酸エチル)

IR (neat) 3310, 1738, 1651, 1614, 1514, 1244, 815 cm⁻¹

実施例190:2-アミノ-2-{2-(4-(1, 1-ジフルオロオクチル) フェニル) エチル} -1, 3-プロパンジオール

実施例191:2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-{2-〔4-(1, 1-ジフルオロオクチル)フェニル〕エチル}プロパン

実施例192:2-rミノ $-2-\{2-\{4-(1,1-i)$ フルオロヘプチルオキシ)フェニル $\}$ エチル $\}$ -1,3-プロパンジオール

実施例193:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-{2-〔4-(1,1-ジフルオロヘプチルオキシ)フェニル〕エチル}プロパ ン

実施例195:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-{2-[4-(4-メチルペンチル)フェニル]エチル}プロパン

実施例197:2-アセトアミド-2- [2-(4-フルオロフェニル) エチル]

-1, 3-プロパンジオール、融点=63~65℃

実施例198:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔2-(4-フ ルオロフェニル)エチル)プロパン

実施例199:2-アミノ-2-〔2- (3-フルオロ-4-オクチルフェニル) エチル〕-1,3-プロパンジオール

実施例200:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[2-(3-フ ルオロ-4-オクチルフェニル)エチル]プロパン

実施例 $2 \ 0 \ 1 : 2 - \mathbb{7} = \mathbb{7} =$

実施例202:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔2-〔2-エ チル-4-オクチルフェニル〕エチル〕プロパン

実施例204:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔2-(3-メ チル-4-オクチルフェニル〕エチル〕プロパン

実施例205:2-アミノ-2-〔2-(4-ヘプチルオキシ-3-メトキシフェニル)エチル〕-1,3-プロパンジオール・1/2水和物・塩酸塩、融点=126~129℃

 ${}^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

0.80 (3H, t, J=6Hz), 1.22-1.36 (8H, m), 1.70-1.76 (2H, m), 1.83-1.91 (2H, m), 2.50-2.54 (2H, m), 3.30 (3H, s), 3.77 (4H, s), 3.89 (2H, t, J=8Hz), 6.63-6.72 (3H, m)

I R ν 3179, 2931, 1617, 1518, 1240, 1036 cm⁻¹

実施例206:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[2-(4-ヘ プチルオキシ-3-メトキシフェニル)エチル]プロパン

融点=138~139℃

 ${}^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

0.88 (3H, t, J=6Hz), 1.30-1.56 (10H, m), 1.96 (3H, s), 2.09 (6H, s),

2.18-2.22 (2H, m), 2.53-2.57 (2H, m), 3.86 (3H, s), 3.97 (2H, t, J=6Hz), 4.35 (4H, s), 5.65 (1H, s), 6.70-6.80 (3H, m)

I R ν 3291, 2930, 1738, 1258 cm⁻¹

元素分析 計算值: C=64.49, H=8.44, N=3.01 分析值: C=64.32, H=8.33, N=3.03

実施例 $2 \ 0 \ 7 : 2 - 7 \in J - 2 - (2 - (4 - ^ プチルオキシ - 3 - ^ メチルフェ ニル) エチル) - 1, 3 - プロパンジオール$

実施例208:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔2-(4-ヘ プチルオキシ-3-メチルフェニル)エチル〕プロパン

実施例209:2-アミノ-2-[2-(4-フェニルメチルオキシフェニル) エチル]-1,3-プロパンジオール・1/5水和物・塩酸塩

融点=207~210℃

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

1. 90-1. 95 (2H, m), 2. 59-2. 63 (2H, m), 3. 71 (4H, q, J=12Hz), 5. 04 (2H, s), 6. 91 (2H, d, J=8Hz), 7. 13 (2H, d, J=8Hz), 7. 37-7. 44 (5H, m) I R ν 3422, 1617, 1508, 1245 cm⁻¹

融点=150~153℃

 $^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

1.95 (3H, s), 2.09 (6H, s), 2.15-2.20 (2H, m), 2.53-2.58 (2H, m), 4.34 (4H, s), 5.04 (2H, s), 5.64 (1H, s), 6.90 (2H, d, J=8Hz), 7.36-7.43 (5H, m)

I R ν 3318, 1763, 1736, 1654, 1250 cm⁻¹

元素分析 計算值: C=67.43, H=6.84, N=3.28

分析值: C=67.47, H=6.96, N=3.19

実施例211:2-アミノ-2-〔2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル)-1,3-プロパンジオール

. 融点=180~185℃

 ${}^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

1.61-1.66 (2H. m), 2.52-2.57 (2H. m), 3.57 (4H. s), 6.74 (2H. d, J=8Hz), 7.03 (2H. d, J=8Hz)

I R ν 3355, 2923, 1602, 1474, 1232 cm⁻¹

元素分析 計算值: C=62.54, H=8.11, N=6.63

分析值: C=62.45, H=8.07, N=6.68

実施例212:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔2-(4-ヒ ドロキシフェニル)エチル〕プロパン

融点=100~105℃

 ${}^{1}H-NMR$ (CDCl₃) δ :

1.98 (3H, s), 2.10 (6H, s), 2.17-2.22 (2H, m), 2.52-2.56 (2H, m),

4. 34 (4H. s). 5. 73 (1H. s). 6. 76 (2H. d. J=9Hz). 7. 03 (2H. d. J=9Hz) I R ν 3590. 1741. 1577. 1243 cm⁻¹

実施例213:2-アミノ-2-(9-フェニルオキシノニル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩

融点=103~104℃

元素分析 計算值: C=62.50, H=9.32, N=4.05 分析值: C=62.21, H=9.39, N=3.95

実施例214:2-アセトアミド-2-(9-フェニルオキシノニル)-1, 3 -プロパンジオール

融点=71~73℃

元素分析 計算值: C=68.34, H=9.46, N=3.99

分析值: C=68.34, H=9.44, N=4.01

実施例215:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(9-フェニル オキシノニル)プロパン

実施例216:2-アミノ-2-(12-フルオロドデシル)-1, 3-プロパンジオール・1/10水和物・塩酸塩、融点=87~89℃

実施例217:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(12-フルオロドデシル)プロパン、融点=57~59℃

- 実施例218:2-アミノ-2-(13-フルオロトリデシル)-1,3-プロ パンジオール、
- 実施例219:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(13-フルオロトリデシル)プロパン、
- 実施例 $2 \ 2 \ 0 : 2 7 \ 2 \{2 \{4 (N デシル N メチルアミノ)$ フェニル $\} \ T \ 2 - \{1, 3 - 7 \ 2 - 1\}$
- 実施例221:2-アセトアミドー1, 3-ジアセトキシー2- $\{2 \{4-$ (N-デシル-N-メチルアミノ) フェニル] エチル $\}$ プロパン
- 実施例222:2-アミノ-2-〔2-(4-ヘプチルチオフェニル)エチル〕 -1,3-プロパンジオール
- 実施例223:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔2- (4-へ プチルチオフェニル)エチル〕プロパン
- 実施例224:2-アミノ-2-〔2-(4-ヘプチルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール
- 実施例225:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔2-(4-ヘ プチルフェニル)エチル〕プロパン
- 実施例227:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔2- (4-ヘ プチルフェニル)-2-オキソエチル〕プロパン
- 実施例 $2 \ 2 \ 8 : 2 7 \le J 2 (2 (4 ^ プチルフェニル) 2 ヒドロキシエチル) 1, 3 プロパンジオール$
- 実施例229:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔2-〔4-へ プチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル〕プロパン
- 実施例 $2 \ 3 \ 0 : 2 \mathbb{7}$ ミノー $2 \{2 \{2 \{2 \{4 \mathbb{7}\}\}\}\}$ カーション -1 カージョン -1 カーション -

ール

実施例231:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-{2-(2-(4-ヘプチルフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル)エ チル}プロパン

実施例232:2-アミノ-2-〔2-(4-オクチルフェニル)-2-オキソ エチル〕-1,3-プロパンジオール

実施例233:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-[2-(4-オ クチルフェニル)-2-オキソエチル]プロパン

実施例 $2\ 3\ 4\ :\ 2-r$ ミノー 2-(2-(4-x)) カーシェニル) -2-ヒドロキシエチル〕 -1 、3-プロパンジオール

実施例235:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔2-〔4-オ クチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル〕プロパン

実施例236:2-アミノ-2-{2-(2-(4-オクチルフェニル)-1, 3-ジオキソラン-2-イル]エチル}-1,3-プロパンジオ ール

実施例237:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-{2-(2-(4-オクチルフェニル)-1,3-ジオキソラン-2-イル]エ チル}プロパン

実施例261:2-アミノ-2-(8-ヒドロキシテトラデシル)-1,3-プロパンジオール塩酸塩

(1) $2-rセタミド-3-rセトキシ-2-rセトキシメチル-14-オキソイコサ-6-エン酸-<math>\delta$ -ラクトン

2-アミノー3,4-ジヒドロキシー2-ヒドロキシメチルー14-オキソイコサー6-エン酸(20g)に無水酢酸(200m1)、ピリジン(20m1)を加え室温で一夜攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、標記化合物(22.9g)を得た。

(2) 14-ヒドロキシー2-アセタミドー3-アセトキシー2-アセトキシメチルー14-オキソイコサー6-エン酸- δ -ラクトン

上記化合物(12.8g)のジオキサン溶液に脱イオン水(150m1)を加える。氷浴下、炭酸ガスを吹き込みながら約30分攪拌し、ガスを飽和させることによって溶液を弱酸性にした。水素化ホウ素ナトリウム(2.41g)を加え、1時間攪拌した。反応溶液を1N塩酸で酸性にした後、1N水酸化ナトリウムで弱酸性にした。これを濃縮後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;クロロホルム:メタノール=50:1)にて精製すると、標記化合物(7.49g)を得た。

IR: 3440, 2920, 2850, 1750, 1680 cm^{-1}

(3) 14-t-7 チルジメチルシリルオキシー2-7 セタミドー3-7 セトキシー2-7 セトキシメチルー14-7 キソイコサー6-1 エン酸ー3-7 ファクトン

上記化合物(7.49g)のN, N-ジメチルホルムアミド(75m1)溶液にイミダゾール(4.97g)、t-ブチルジメチルシリルクロライド(5.50g)を加え、60℃で1時間攪拌した。反応溶液を氷冷下、脱イオン水を加え、30分攪拌後、室温で30分攪拌した。脱イオン水を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。ジエチルエーテル層を濃縮し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:2)にて精製すると、標記化合物(8.50g)を得た。

IR: 3440, 2920, 2850, 1750, 1680, 830 cm⁻¹

(4) 5, 6-ジヒドロキシー 14-t-ブチルジメチルシリルオキシー 2-アセタミドー 3-アセトキシー 2-アセトキシメチルー 14-オキソイコサー 6-エン酸ー $\delta-$ ラクトン

上記化合物 (8.50g) のアセトン (207m1) 溶液に、N-メチルモルホリン-N-オキシド (3.19g)、1%オスミウム水溶液 (34.5m1) を加え、室温で2時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢

酸エチル層を飽和亜硫酸ナトリウム溶液1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム溶液、 飽和食塩水にて順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、標記 化合物(8.05g)を得た。

IR: 3440, 2920, 2850, 1750, 1680, 830 cm⁻¹

(5) 8-t-ブチルジメチルシリルオキシテトラデカナール

上記化合物(8.05g)のジオキサン(610m1)溶液に0.2N過ヨウ素酸ナトリウム水溶液(183m1)を加え、室温で2時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、ヘキサンにて抽出し、ヘキサン層を硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、標記化合物(4.1g、収率98.4%)を得た。

IR: 2920, 2850, 1720, 830 cm $^{-1}$

(6) 8-t-プチルジメチルシリルオキシテトラデカノール

上記化合物(4.1g)のジオキサン(120m1)溶液に脱イオン水(40m1)を加え、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム(1.15g)を加える。室温で30分攪拌した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:10)にて精製すると、標記化合物(3.74g)を得た。

IR: 2920, 2850, 1710, 830 cm⁻¹

(7) 1-ヨードー8-t-プチルジメチルシリルオキシテトラデカン

上記化合物(3.74g)のベンゼン(200m1)溶液にイミダゾール(1.85g)、トリフェニルホスフィン(7.14g)、ヨウ素(5.53g)を加え、室温で30分攪拌した。酢酸エチルにて抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、酢酸エチル層を硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;ヘキサン)にて精製すると、標記化合物(4.42g)を得た。

IR: 2920. 2850. 830 cm $^{-1}$

·ル) マロン酸ジエチル

上記化合物(4.42g)の脱水エタノール(200m1)溶液にアセトアミドマロン酸ジエチル(2.54g)、ナトリウムエトキシド(0.80g)を加え、窒素気流下、一夜、加熱還流した。反応溶液を濃縮後、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:10)にて精製すると標記化合物(2.81g)を得た。

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.03 (6H, s), 0.84 (9H, m), 1.23 (18H, m), 1.23 (3H, t, J=7.0Hz),

1.35 (3H, m), 2.01 (3H, s), 2.28 (2H, m), 3.57 (1H, q, J=6.0Hz),

4.215 (2H, q, J=7Hz), 6.74 (1H, s)

IR: 3440, 2920, 2850, 1740, 1680, 830 cm⁻¹

(9) 2-rセトアミドー1, 3-3アセトキシー2 – (8-t-7)チルジメチルシリルオキシテトラデシル) プロパン

上記化合物(3.38g)のメタノール(13m1)溶液に水素化ホウ素ナトリウム(1.77g)を加え、室温で1時間放置後、反応溶液を酢酸エチルにて抽出し、1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄した。酢酸エチル層を硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。得られた残渣に無水酢酸(19.6m1)、ピリジン(1.96m1)を加え、室温で一夜攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:2)にて精製すると、標記化合物(2.04g)を得た。

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.009 (6H, s), 0.86 (3H, t), 0.86 (9H, s), 1.24 (18H, m), 1.36 (4H,

m), 1.82 (2H, m), 1.94 (3H, s), 2.06 (6H, s), 3.58 (1H, q, J=8Hz).

4. 26 (2H, d, J=11. 2Hz), 4. 29 (2H, d, J=11. 3Hz), 5. 59 (1H, s)

IR: 3440, 2920, 2850, 1740, 1680, 830 cm $^{-1}$

(00) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(8-ヒドロキシテトラデシル) プロパン

上記化合物(2.04g)の0.01N塩酸-メタノール(37.6m1)溶液を室温で3時間放置した。脱イオン水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和塩化ナトリウム溶液にて順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:1)にて精製すると、標記化合物(1.15g)を得た。

融点=82~84℃

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.85 (3H, t, J=6.9Hz), 1.26 (18H, m), 1.40 (4H, m), 1.82 (2H, m),

1.93 (3H, s), 2.05 (6H, s), 3.55 (1H, m), 4.25 (2H, d, J=11.2Hz).

4. 28 (2H, d, J=11. 7Hz), 5. 59 (1H, s)

IR: 3440, 2920, 2850, 1720, 1680 cm⁻¹

(11) 2-アミノ-2-(8-ヒドロキシテトラデシル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

上記化合物(300mg)のメタノール(12.6m1)溶液に1N水酸化ナトリウムを加え、窒素気流下、6時間加熱還流した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣に1N塩酸-メタノール(1.4m1)を加え、濃縮すると標記化合物(230mg)を得た。

融点=106~108℃

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.84 (3H. t, J=6.8Hz), 1.22 (22H. m), 1.48 (2H. d, J=10.3Hz), 3.40 (2H. d, J=10.3Hz), 3.44 (2H. d, J=12.2Hz), 4.21 (1H. m), 5.28 (2H. br.s), 7.74 (3H. br.s)

IR: 3350, 2900, 2850 cm⁻¹

実施例262:2-アミノー2-(8-オキソテトラデシル)-1,3-プロパ

ンジオール塩酸塩

(1) 2-rv+r=1, 3-irv+r=2-(8-rv+r)rv+r=1, rv+r=1

2-アセトアミドー1,3-ジアセトキシー2-(8-ヒドロキシテトラデシル)プロパン(300mg)のジクロロメタン(19m1)溶液に、クロロクロム酸ピリジニウム(301.5mg)を加え、窒素気流下、室温で2時間攪拌した。エーテル(38m1)、硫酸マグネシウム(適量)を加え、10分攪拌後、吸引濾過し、濾液を濃縮した。酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、標記化合物(290mg)を得た。

融点=88~89%

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.88 (3H, t, J=7.1Hz), 1.27 (14H, m), 1.55 (4H, m), 1.84 (2H, dd, J=8.8, 15.6Hz), 2.08 (6H, s), 2.38 (4H, t, J=7.4Hz), 4.28 (2H, d, J=11.3Hz), 4.31 (2H, d, J=11.2Hz), 5.63 (1H, s)

IR: 2920, 2850, 1740~1680 cm⁻¹

(2) 2-アミノ-2-(8-オキソテトラデシル)-1, 3-プロパンジオール 塩酸塩

上記化合物(290mg)のメタノール(12.2m1)溶液に1N水酸化ナトリウム(4.1m1)を加え、窒素気流下、6時間、加熱還流した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶液を留去し、得られた残渣に1N塩酸-メタノール(1.2m1)を加え濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルにて再結晶すると、標記化合物(176mg)を得た。

融点=121~122℃

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.614 (3H, t, J=6.3Hz), 1.03 (18H, m), 1.28 (4H, m), 1.41 (2H, m).

2. 12 (4H, t, J=7. 3Hz), 3. 38 (2H, d, J=12. 2Hz), 3. 48 (2H, d, J=12. 2Hz).

4.71 (2H, br.s), 7.65 (3H, br.s)

IR: 3420~3340, 3030, 2920, 2850, 1700 cm⁻¹

実施例 2 6 3 : 2 - アミノー 2 - (2 - N - ドデシルアミノエチル) - 1, 3 - プロパンジオール塩酸塩

(1) アミノマロン酸ジエチル塩酸塩10gをN, N-ジメチルホルムアミド100 m1に溶解し、トリエチルアミン6. 3gおよびジーt-ブチルジカーボネート12. 1gを加え、60 $\mathbb C$ にて1 時間、攪拌した。氷冷下、反応液に水を加え、室温で攪拌後、エーテル抽出し、脱水後、濃縮した。さらにヘキサンー酢酸エチル($10:1 \to 5:1$)を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色油状物のN-t-ブトキシカルボニルアミノマロン酸ジエチル13gを得た。

IR ν_{max} (CHC1₃): 3450, 2970, 1740(sh), 1710, 1490, 1375, 1340, 1160, 1060, 1020, 860 cm⁻¹

(2) N-t-プトキシカルボニルアミノマロン酸ジエチル5gを脱水エタノール100m1に溶解し、ナトリウムエトキシド1.53gおよび臭化アリル2.7gを加え、窒素雰囲気下、12時間還流した。反応液を濃縮し、ヘキサン-酢酸エチル(20:1→10:1→8:1)を展開後としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色油状物の2-アリル-<math>N-t-プトキシカルボニルアミノマロン酸ジエチル4.8gを得た。

IR ν_{max} (CHC1₃): 3450, 2980, 2860, 1740(sh), 1710, 1480, 1400, 1370, 1310, 1160, 1080, 1060, 1020, 915, 860 cm⁻¹

(3) 2-アリル-N-t-プトキシカルボニルアミノマロン酸ジエチル4.8g をメタノール30m1に溶解し、水素化ホウ素ナトリウム4.34gを加え、室温で2時間放置した。反応液に酢酸エチルを加え、1N-塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄後、脱水、濃縮した。残渣をN,N-ジメチルホルムアミド32m1に溶解し、イミダゾール5.72gおよび塩化t-プチルジメチルシリル6.33gを加え、60℃で1時間、攪

伴した。氷冷下、反応液に水を加え、室温で攪拌後、エーテル抽出し、脱水後、 濃縮した。さらにヘキサンー酢酸エチル(10:1)を展開液としたシリカゲル カラムクロマトにより精製し、無色油状物の2-アリルー2-(N-t-ブトキ シカルボニルアミノ) -1, 3-プロパンジオール ビス-t-ブチルジメチル シリルエーテル 3. 8 g を 得た。

Rf値=0.7(ヘキサン-酢酸エチル=10:1)

(4) 2-アリルー2-(N-t-プトキシカルボニルアミノ)-1,3-プロパンジオール ビス-t-プチルジメチルシリルエーテル3.8gをアセトン300m1に溶解し、N-メチルモルホリン-N-オキシド2.45gおよび1%四酸化オスミウム水溶液43m1を加え、室温で4時間、攪拌した。反応液を濃縮し、酢酸エチルを加え、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液、1N塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄した。脱水後、濃縮し、無色油状物の2-(2,3-ジヒドロキシプロピル)-2-(N-t-プトキシカルボニルアミノ)-1,3-プロパンジオール ビス-t-ブチルジメチルシリルエーテル4.3gを得た。

IR ν_{max} (CHCl₃): 3450(br). 2940, 2850, 1710, 1500, 1470, 1400. 1370, 1260, 1160, 1080(br), 840 cm⁻¹

R f 値= 0.7 (ヘキサン-酢酸エチル= 5:1)

(6) 2-(N-t-プトキシカルボニルアミノ)-2-(2-ホルミルエチル) -1, 3-プロパンジオール ビス-t-プチルジメチルシリルエーテル1. 2 gをメタノール <math>20m1 に溶解し、氷冷下、ドデシルアミン 2.89 gの濃塩酸

ーメタノール(1:11)5.2 m 1 溶液、および水素化シアノホウ素ナトリウム 245 m g を加え、室温で一夜、攪拌した。反応液を濃縮し、酢酸エチルを加え、1 N 塩酸水溶液を水層が酸性を呈するまで加え、さらに1 N 水酸化ナトリウム水溶液を水層が弱アルカリ性を呈するまで加えた後、分液した。酢酸エチル層を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、脱水後、濃縮した。さらに、ヘキサンー酢酸エチル(3:1→2:1→1:1)を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色油状物の2-(2-N-ドデシルアミノエチル)-2-(N-t-プトキシカルボニルアミノ)-1,3-プロパンジオールビス-t-プチルジメチルシリルエーテル956 m g を得た。

IR ν_{max} (CHCl₃): 3450, 2920, 2850, 1710, 1500, 1460, 1400, 1370, 1260, 1160, 1100(br), 840 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

5.31 (1H. s. NHBoc), 3.69 (2H. d. 8Hz, OCH₂s×2), 3.61 (2H. d. 8Hz, OCH₂s×2), 2.66 (2H. t. 8Hz, H₂C-N), 2.55 (2H. t. 8Hz, N-CH₂), 1.85 (2H. t. 8Hz, -C-CH₂), 1.40 (9H. s. Boc.-t-Bu), 1.24 (20H. m. CH₂×10), 0.85 (21H. m. Si-tBu×2 およびCH₂CH₃), 0.03 (12H. s. Si-CH₃×4)

(7) 2-(2-N-)ドデシルアミノエチル)-2-(N-t-)プトキシカルボニルアミノ)-1, 3-プロパンジオール ビスーt-プチルジメチルシリルエーテル100mgをメタノール2m1に溶解し、濃塩酸-メタノール(1:11)1.6m1を加え、40°Cで3時間加温した。反応液を濃縮し、淡黄色油状物の2-アミノ-2-(2-N-)ドデシルアミノエチル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩58mgを得た。

IR ν_{mex} (KBr): 3350(br), 2920, 2850, 1600, 1460, 1060 ¹H-NMR (DMSO-d₆)δ:

9.00 (2H, br.s, ${}^{+}N\underline{H}_{2}C1^{-}$), 8.04 (3H, br.s, ${}^{+}NH_{3}C1^{-}$), 5.51 (2H,

s. $OH \times 2$), 3.47 (2H, s, OCH_2), 3.45 (2H, s, OCH_2), 2.99 (2H, m, H_2CN),

2.81 (2H. m. NCH_2), 1.96 (2H. m. $-C-CH_2$), 1.23 (20H. m. $CH_2 \times 10$),

0.84 (3H, t, 6.8Hz, CH₃)

*実施例264:2-アミノ-2-(11-メトキシカルボニルウンデシル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

2-アセトアミドー1, 3-ジアセトキシー2-(12-ヒドロキシドデシル)プロパン426mgを乾燥ジメチルホルムアミド2.7m1に溶解し、ピリジニウムジクロメイト1.345gを加えて窒素雰囲気下室温で一昼夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、エーテルで2回抽出し、エーテル層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。残渣にメタノール17m1と1N-水酸化ナトリウム水溶液4.23m1を加えて、窒素雰囲気下、6時間加熱還流した。反応液を強酸性イオン交換樹脂アンバーライトIR-120Bカラムに通液し、溶出液を濃縮した。濃縮残渣をメタノールに溶解し、塩酸酸性とした後、減圧下に溶媒を留去し、標記化合物122mgを得た。

融点=100.0~104.0℃

IR (cm⁻¹) : 3370, 2920, 2850, 1740, 1500, 1470, 1170, 1080 NMR (DMSO) δ :

7.684 (3H, br.s), 5,275 (2H, br.s), 3.563 (3H, s), 3.441 (1H, d, J=11.2Hz), 3.430 (1H, d, J=11.2Hz), 3.402 (1H, d, J=11.7Hz), 3.390 (1H, d, J=11.2Hz), 2.272 (2H, t, J=7.3Hz), 1.229 (20H, s)

実施例265:2-アミノー2-(11-カルボキシウンデシル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

2-r > 1-2-(11-y)トキシカルボニルウンデシル)-1, 3-7ロパンジオール塩酸塩10mgに2N-塩酸0.5m1を加えて<math>90℃で1時間加熱した。減圧下に溶媒を留去して、標記化合物10mgを得た。

NMR (DMSO) δ :

11.992 (1H, br.s, C00H), 7.771 (3H, br.s, ${}^{+}NH_3$), 5.292 (2H, t, J=4.9Hz, OH×2), 3.417 (4H, ddd, J=16.5, 11.7, 5.0Hz, CH₂0×2),

2.168 (2H, t, J=7.4Hz, CH₂COO), 1.224 (20H, s, CH₂ \times 10)

実施例266:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(8-アセトキ シテトラデシル)プロパン

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.85 (3H. t. J=6.8Hz), 1.24 (18H. m), 1.47 (4H. m), 1.82 (2H. m).

1. 94 (3H. s), $2.05\sim2.01$ (9H. s), 4.25 (2H. d. J=11.7Hz), 4.29 (2H,

d, J=11.7Hz), 4.83 (1H, q, J=6.3Hz), 5.62 (1H, s)

IR: 3400, 2920, 2850, 1720, 1680 cm⁻¹

実施例267:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(3,7,11 -トリメチルドデシル)プロパン

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

5.589 (1H. br.s), 4.293 (4H. dd. J=13.7, 12.3Hz), 2.073 (6H, s),

1.956 (3H, s), 1.857 (1H, qui, J=13.7Hz), 1.844 (1H, qui, J=13.3Hz),

1.513 (1H, 7重線, J=6.6Hz), 1.345~1.040 (16H, m), 0.857 (6H, d.

J=6.4Hz), 0.848 (3H, d, J=6.4Hz), 0.831 (3H, d, J=6.8Hz)

実施例268:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-(3,7,11-ト リメチル-2,6,10-トリデセニル)プロパン

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

5.57 (1H. br.s). 5.07 (3H. m), 4.28 (4H. s), 2.60 (2H. d. J=7.8Hz),

2.01 (6H, s), 2.05 ~1.94 (8H, m), 1.94 (3H, s), 1.70~1.57 (12H, m)

実施例269:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(11-メトキ) シカルボニルウンデシル)プロパン

融点=49.5~51.5℃

I R ν : 3300, 2930, 2850, 1740, 1655, 1580, 1475, 1390, 1240, 1060 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

(2H, m), 1.225 (18H, br.s)

5. 61 (1H, br. s), 4. 265 (4H, dd, J=13. 6Hz, 11. 2Hz), 3. 635 (3H, s), 2. 272 (2H, t, J=7. 6Hz), 2. 051 (6H, s), 1. 934 (3H, s), 1. 836 ~1. 817

実施例270:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-(12-アセトキシ ドデシル)プロパン

融点=67.5~69.0℃

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

5. 607 (1H, br. s), 4.267 (4H, dd, J=13.7, 11.3Hz), 4.021 (2H, t, J=6.9Hz), 2.052 (6H, s), 2.017 (3H, s), 1.934 (3H, s), 1.840 ~1.819 (2H, m), 1.225 (20H, br. s)

実施例271:2-アミノ-2-(1, 2, 12-トリヒドロキシオクタデシル) -1, 3-プロパンジオール

 $^{1}H-NMR$ (400MHz, in CD₃OD) δ :

3.85~3.73 (7H, m), 1.60 (2H, m), 1.45~1.25 (26H, m), 0.90 (3H, t)

IR ν_{max} (KBr): 3350(br), 2920, 2850, 1560, 1480, 1420, 1060 cm⁻¹

 $^{1}H-NMR$ (400MHz, in CD₃OD) δ :

5.48 (2H. m), 3.86~3.72 (6H. m), 2.44 (4H. t), 2.29 (2H. t), 2.02 (2H. t), 1.53 (4H. quintet), 1.29 (12H. br.s), 0.89 (3H. t)

IR ν_{max} (CHC1₃): 3300, 2925, 2850, 1710, 1560, 1420, 1060, 980 cm⁻¹

実施例 273:2-7ミノー2-(1, 2-3)ヒドロキシー12-ヒドロキシイミノオクタデシル)-1, 3-プロパンジオール

 ${}^{1}H-NMR$ (400MHz, in CD₃OD) δ :

3.85~3.73 (4H, m), 2.42 (2H, t), 2.15 (2H, t), 1.62~1.32 (24H, m), 0.89 (3H, t)

 $IR\nu_{max}$ (CHCl₃): 3300(br), 2920, 2850, 1560, 1420, 1050 cm⁻¹ 実施例 2 7 4: 2 - アミノー 2 - (1, 2, 12 - トリヒドロキシー 4 - オクタ デセニル) - 1, 3 - プロパンジオール

2-アミノ-3-ヒドロキシ-2-(1, 2-ジヒドロ-12-オキソ-4-オクタデセニル)プロピオン酸のラクトン体2.00gを乾燥テトラヒドロフラン66m1に溶解し、室温で攪拌しながら水素化アルミニウムリチウム800m

gを少量ずつ加えた。混合物を室温で40分間攪拌後、水0.8m1、15%水酸化ナトリウム水溶液0.8m1、水2.4m1を順次加え、不溶物を濾去した。得られた濾液を減圧濃縮し、残渣を水洗後、減圧下で乾燥し、標記化合物408mgを得た。

IR ν_{max} (KBr): 3280, 2920, 2850, 1640, 1470, 1400, 1075, 970 cm⁻¹

 1 H-NMR (3 0 0 MHz, in CD₃ OD, Ref:TMS), δ : 5.57 (1H. dt. J=15.3 and 6.6Hz), 5.43 (1H. dt. J=15.3 and 6.9Hz), 3.85 (1H. dt. J=6.9 and 1.0Hz), 3.84 \sim 3.73 (5H. m), 3.67 (1H. d. J=1.0Hz), 2.31 (2H. br. t. J=6.7Hz), 2.02 (2H. br. q. J=6.4Hz), 1.42 \sim 1.31 (20H. m), 0.90 (3H. t. J=6.8Hz)

実施例275:2-アミノ-2-(1, 2-ジヒドロキシ-4-オクタデセニル) -1, 3-プロパンジオール

2-アミノー3-ヒドロキシー2-(1, 2-ジヒドロキシー4-オクタデセニル)プロピオン酸のラクトン体978mgと水素化アルミニウムリチウム403mgとを乾燥テトラヒドロフラン33m1中で実施例274の方法に準じて、反応させることにより、標記化合物222mgを得た。

IR ν_{max} (KBr) cm⁻¹: 3300, 2920, 2850, 1575, 1480, 1390, 1060, 1105, 975

 $^{1}H-NMR$ (2 0 0 MHz, in CD₃ OD, Ref:TMS), δ : 5.57 (1H, dt, J=15.4 and 6.4Hz), 5.42 (1H, dt, J=15.4 and 6.5Hz), 3.88~3.66 (6H, m), 2.31 (2H, t, J=6.7Hz), 2.04~1.93 (2H, m), 1.28 (22H, br.s), 0.90 (t, J=6.5Hz)

実施例276:2-アミノ-2-(1, 2-ジヒドロキシオクタデシル)-1, 3-プロパンジオール

2-アミノー2-(1, 2-ジヒドロキシー4-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール68.0mgをメタノール14m1に溶解し、5%パラジウム -炭素を6.8mg加え、常温、常圧で一昼夜接触還元を行った。反応後、触媒

を濾別し、濾液を減圧濃縮し、標記化合物34.3mgを得た。

IR ν_{max} (KBr) cm⁻¹: 3300, 2920, 2850, 1575, 1460, 1370, 1060 . 'H-NMR (200MHz, in CD₃OD, Ref:TMS), δ :

3.77 (6H, m), 1.65 (2H, m), 1.27 (28H, br.s), 0.89 (3H, t, J=6.5Hz) 実施例277:2-アミノ-2-(1, 12-ジヒドロキシ-4-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール

実施例274の方法に準じて、2-アミノ-3-ヒドロキシ-2-(1-ヒドロキシ-12-オキソ-4-オクタデセニル)プロピオン酸35.0mgと水素化アルミニウムリチウム14.4mgとを乾燥テトラヒドロフラン2.0m1中で反応させることにより、標記目的物8.9mgを得た。

IR ν_{max} (KBr) cm⁻¹: 3300, 2920, 2850, 1640, 1400, 970 ¹H-NMR (2 0 0 MHz, in CD₃ OD, Ref:TMS), δ: 5.40 (2H, m), 3.97~3.70 (5H, m), 3.58 (1H, m), 1.94 (4H, m), 1.70~ 1.21 (22H, m), 0.88 (3H, t, J=6.5Hz)

上記と同様にして次の化合物が得られる。

実施例278:2-アミノ-2-(1, 2, 12-トリヒドロキシオクタデシル)-1, 3-プロパンジオール

実施例279:2-アミノ-2-(1, 12-ジヒドロキシオクタデシル)-1, 3-プロパンジオール

実施例 $2 \ 8 \ 0 : 2 - T \ge J - 2 - (2 - (4 - \mathbb{1}) - \mathbb{1})$ エチル) -1 、 $3 - \mathbb{1}$ ロパンジオール

(1) 2-(4-ヘプチルオキシフェニル)エタノール
メタノール(120m1)に2-(4-ヒドロキシフェニル)エタノール(10.
0g)とナトリウムメトキシド(4.30g)を加え、30分間加熱還流した。
これにヘプチルブロマイド(14.2g)のメタノール(30m1)溶液を滴下し、加熱還流下6時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒:酢酸

'エチル: ヘキサン=1:2) にて精製すると、標記化合物(10.81g) を得た。

融点=37~39℃

Rf値:0.44(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.89(3H. t. J=6.0Hz), 1.10-1.99(11H. m), 2.81(2H. t. J=6.25Hz), 3.68-

4.05(4H. m), 6.85(2H, d, J=8.7Hz), 7.15(2H, d, J=8.7Hz)

IR: 3312, 1610, 1514, 1249 cm⁻¹

 $MS (EI) : 236(M^{+})$

(2) $2 - (4 - \sqrt{7} + \sqrt$

上記化合物(10.81g)のテトラヒドロフラン(300m1)溶液にトリエチルアミン(4.2g)を加え、氷冷した。これにメタンスホニルクロライド(5.23g)を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:5)にて精製すると、標記化合物(11.32g)を得た。

融点=35~36℃

Rf値:0.33(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.90(3H, t. J=6.0Hz), 1.10-1.95(10H, m), 2.86(3H, s), 3.00(2H, t.

J=7.5Hz), 3.94(2H, t, J=6.3Hz), 4.39(2H, t, J=7.0Hz), 6.85(2H, d,

J=8.7Hz), 7.15(2H, d, J=8.7Hz)

IR: 1354, 1516, 1249cm⁻¹

 $MS (E I) : 314(M^{+})$

(3) 2 - $(4 - \gamma)^2 + (4 - \gamma$

上記化合物(11.32g)の2-ブタノン(400m1)溶液にヨウ化ナト リウム(10g)を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルに

て抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒:酢酸エチル:ヘキサン=1:5)にて精製すると、標記化合物(9.07g)を抽出物として得た。

Rf値:0.80(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.89(3H, t, J=6.0Hz), 1.10-1.96(10H, m), 2.98-3.48(4H, m), 3.94(2H,

t, J=6.3Hz), 6.84(2H, d, J=8.7Hz), 7.11(2H, d, J=8.7Hz)

IR: 1610. 1512. 1246cm⁻¹

 $MS (EI) : 346(M^{+})$

(4) ジエチル $2-rセトアミド-2-(4-<math>^{\prime}$ プチルオキシフェニル) エチル マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル(15g)に窒素気流下、ナトリウムエトキシド(4.99g)の無水エタノール(60m1)溶液を滴下し、65℃で30分 攪拌した。次に、上記化合物(8.0g)のテトラヒドロフラン(30m1)溶液を滴下し、65℃で6時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:5)にて精製すると、標記化合物(6.50g)を得た。

融点=77~80℃

Rf値: 0. 44 (クロロホルム: メタノール=9:1)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.89(3H, t, J=6.0Hz), 1.05-1.90(16H, m), 1.98(3H, s), 2.10-2.85(4H,

m), 3.92(2H, t, J=7.0Hz), 4.21(4H, q, J=7.5Hz), 6.65(1H, br.s),

6. 79(2H, d, J=8. 7Hz), 7. 05(2H, d, J=8. 7Hz)

IR: 3242, 1745, 1641, 1614, 1512, 1296 cm^{-1}

 $MS (E I) : 435(M^{+})$

'(5) 1.3-プロパンジイルー2-アセトアミド-2-〔2-(4-ヘプチルオ キシフェニル) エチル] イリデンジアセテート

水素化アルミニウムリチウム(1.70g)の無水テトラヒドロフラン溶液 (150m1)に、窒素気流下、上記化合物(6.50g)の無水テトラヒドロフ ラン溶液 (50m1)を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液 に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え生成する水酸化アルミニウムを濾別後、溶媒 を留去し、残渣にピリジン(66ml)を加えた。氷冷下、無水酢酸(14ml) を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽 出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥 後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒:酢酸 エチル)にて精製すると、標記化合物(4.54g)を白色結晶として得た。

融点=89~91℃

Rf値: 0. 35 (クロロホルム: メタノール=9:1)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.89(3H, t, J=6.0Hz), 1.05-2.72(14H, m), 1.95(3H, s), 2.08(6H, s).

3. 92(2H, t. J=7.0Hz), 4. 34(4H, s), 5. 65(1H, br.s), 6. 80(2H, d.

J=8. 7Hz), 7.10(2H, d, J=8. 7Hz)

IR: 3308, 1739, 1651, 1614, 1514, 1246 cm⁻¹

 $MS (E I) : 435(M^{+})$

(6) 2-アミノー2-〔2-(4-ヘプチルオキシフェニル)エチル〕1、3-プロパンジオール塩酸塩

上記化合物 (4.54g) のメタノール (70m1) ーテトラヒドロフラン (70m1)溶液に水酸化リチウム(3.93g)の水溶液(100m1)を加え、 3 時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を 飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、酢 酸エチルにて再結晶した。得られた結晶のテトラヒドロフラン(28m1)ーメ タノール(28ml)溶液に1M塩酸/エーテル溶液(43m1)を加えた。溶 媒を留去し、析出した結晶を酢酸エチルにて再結晶することによって、標記化合

物(1.30g)を得た。

融点=111~112℃

Rf値: 0. 20 (クロロホルム: メタノール=5:1)

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.88(3H, t, J=5.5Hz), 1.10-1.91(14H, m), 3.56(4H, t, J=5.0Hz), 5.36 (2H, t, J=4.5Hz), 6.84(2H, d, J=8.7Hz), 7.13(2H, d, J=8.7Hz), 7.85 (2H, br.s)

IR: 3279, 1610, 1514, 1246 cm⁻¹

 $MS (E I) : 309(M^{+})$

元素分析 計算値 C; 62.50, H; 9.32, N; 4.05 分析値 C: 62.06, H; 9.11, N; 4.13

実施例281:2-アミノ-2-〔2-(4-ノニルオキシフェニル)エチル〕 -1,3-プロパンジオール

(1) 2-(4-ノニルオキシフェニル) エタノール

メタノール(120m1)に2-(4-ヒドロキシフェニル)エタノール(10.0g)とナトリウムメトキシド(4.30g)を加え、30分間加熱還流した。これにノニルプロマイド(33g)のメタノール(20m1)溶液を滴下し、加熱還流下6時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製すると、標記化合物(20g)を得た。

Rf値:0.46(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:2)

(2) 2-(4-ノニルオキシフェニル)エチルメタンスルフォネート

上記化合物(20g)のテトラヒドロフラン(500m1)溶液にトリエチルアミン(8.8g)を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロライド(9.17g)を滴下し、室温にて4時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、

得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製すると、標記化合物(19.6g)を得た。

融点=37~42℃

Rf値:0.45(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.89(3H, t, J=6.9Hz), 1.05-1.90(16H, m), 2.82(3H, s), 2.99(2H, t, J=6.1Hz), 3.90(2H, t, J=6.9Hz), 4.35(2H, t, J=6.9Hz), 6.78(2H, d,

J=8.3Hz), 7.06(2H, d, J=8.3Hz)

IR: 1354, 1251 cm⁻¹

 $MS (EI) : 342(M^{+})$

(3) 2-(4-ノニルオキシフェニル) エチル ヨーダイド

上記化合物(19.6g)の2-ブタノン(650m1)溶液にヨウ化ナトリウム(17g)を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製すると、標記化合物(18.08g)を油状物として得た。

Rf値:0.69(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.90(3H. t. J=5.5Hz), 1.05-1.90(14H, m), 2.90-3.40(4H, m), 3.90(2H.

t, J=6.9Hz), 6.76(2H, d, J=8.3Hz), 7.02(2H, d, J=8.3Hz)

IR: 1610. 1512. 1246 cm⁻¹

 $MS (EI) : 374(M^{+})$

(4) ジエチル 2- 2- 7 +

アセトアミドマロン酸ジエチル(31g)に窒素気流下、ナトリウムエトキシド(10.4g)の無水エタノール(135m1)溶液を滴下し、65 $^{\circ}$ で30分間攪拌した。次に、上記化合物(18g)のテトラヒドロフラン(63m1)

溶液を滴下し、65 ℃で 6 時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製すると、標記化合物(8.78g)を得た。

融点=76~77℃

Rf値:0.38(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:2)

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

- 0.89(3H, t, J=6.8Hz), 1.05-1.80(20H, m), 1.99(3H, s), 2.20-2.75(4H,
- m), 3.88(2H, t, J=6.2Hz), 4.15(4H, q, J=6.9Hz), 6.70(1H, br.s),
- 6.72(2H, d, J=8.3Hz), 6.99(2H, d, J=8.3Hz)

IR: 3281, 1743, 1645, 1512, 1246 cm⁻¹

 $MS (E I) : 463(M^{+})$

(5) 1, 3 - プロパンジイル-2-アセトアミド-2-〔2-〔4-ノニルオキシフェニル〕エチル〕イリデンジアセテート

水素化アルミニウムリチウム(1.79g)の無水テトラヒドロフラン溶液(150ml)に、窒素気流下、上記化合物(8.78g)の無水テトラヒドロフラン溶液(50ml)を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え生成する水酸化アルミニウムを濾別後、溶媒を留去し、残渣にピリジン(84ml)を加える。氷冷下、無水酢酸(18ml)を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出する。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル)にて精製すると、標記化合物(5.62g)を白色結晶として得た。

融点=88~94℃

Rf値:0.50(クロロホルム:メタノール=9:1)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.89(3H, t, J=6.9Hz), 1.05-2.30(18H, m), 1.93(3H, s), 2.06(6H, s),

3.89(2H, t. J=7.0Hz), 4.30(4H, s), 5.60(1H, br.s), 6.72(2H, d, J=8.2Hz), 7.01(2H, d, J=8.2Hz)

IR: 3308, 1738, 1651, 1614, 1514, 1246 cm⁻¹

 $MS (E I) : 463(M^{+})$

元素分析 計算値 C; 67.36, H; 8.91, N; 3.02 分析値 C; 67.35, H; 8.77, N: 3.05

(6) 2-アミノ-2-〔2-(4-ノニルオキシフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

上記化合物(5.62g)のメタノール(86m1)ーテトラヒドロフラン(86m1)溶液に水酸化リチウム(4.57g)の水溶液(54m1)を加え、3時間加熱環流した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、酢酸エチルにて結晶した。得られた結晶のテトラヒドロフラン(40m1)ーメタノール(40m1)溶液に1M塩酸/エーテル溶液(20m1)を加えた。溶媒を留去し、析出した結晶を酢酸エチルにて再結晶することによって、標記化合物(2.10g)を得た。

融点=106~108℃

Rf値: 0. 14 (クロロホルム: メタノール=5:1)

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.85(3H, t, J=4.1Hz), 1.10-1.90(18H, m), 3.50(4H, d, J=4.7Hz), 3.88 (2H, t, J=5.4Hz), 5.32(2H, t, J=4.9Hz), 6.75(2H, d, J=8.2Hz), 7.02 (2H, d, J=8.2Hz), 7.81(2H, br.s)

I R: 3277, 1610, 1514, 1248 cm⁻¹

 $MS (E I) : 337(M^{+})$

元素分析值 計算值 C; 64.24, H; 9.70, N; 3.75 分析值 C; 64.16, H; 9.51, N; 3.70

実施例 $2 \ 8 \ 2 : 2 - r \ge J - 2 - (2 - (4 - (N - n) + n) - x + n + n = x + n + n = x + n + n = x + n$

˙(1) 2-(4-ヘプタノイルアミノフェニル)エタノール

テトラヒドロフラン(300ml)に2-(p-アミノフェニル)エチルアルコール(13.8g)とトリエチルアミン(10.8g)を加え、氷冷下30分間攪拌した。これに塩化ヘプタノイル(15g)を滴下し、氷冷下30分間攪拌した。さらに、室温で3時間攪拌した後、反応溶液を、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣について酢酸エチルーイソプロピルアルコールで再結晶することにより、標記化合物(13.15g)を得た。

融点=105~110℃

R f 値: 0. 41 (酢酸エチル: n-ヘキサン=1:2→1:1)

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.89(3H, t, J=6.8Hz), 1.31-1.42(8H, m), 1.70(2H, tt. J=7.3Hz,

J=7.8Hz), 2.35(2H, t, J=7.3Hz), 2.83(2H, t, J=6.4Hz), 3.84(2H, dd,

J=6.3Hz, J=5.8Hz), 7.12(1H. br.s), 7.18(2H. d. J=8.3Hz), 7.45(2H. d. J=8.3Hz)

IR: 3302, 1660, 1593, 1412 cm^{-1}

 $MS (E I) : 249(M^{+}1)$

元素分析值 計算值 C; 70.97. H; 9.33. N; 5.52 分析值 C: 71.30. H: 9.26. N: 5.66

(2) $2-(4-\Lambda Tg)/(4nr)$ フェニル)エトキシテトラヒドロピランテトラヒドロフラン(50m1)とジクロロメタン(50m1)に上記化合物(7.0g)、3,4-ジヒドロ-2H-ピラン(<math>3.08g)とp-トルエンスルホン酸(<math>180mg)を加え、7時間室温で攪拌した。これにトリエチルアミン(<math>0.5m1)を加え、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル: Λ キサン=1:1)にて精製すると、標記化合物(11g)を得た。

融点=66~68℃

R f 値: 0. 7 2 (酢酸エチル: n - ヘキサン=1:1)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.89(3H, t, J=6.4Hz), 1.31-2.05(14H, m), 2.34(2H, t, J=7.3Hz), 2.87 (2H, t, J=6.4Hz), 3.47(2H, t, J=6.4Hz), 3.47(2H, dt, J=7.3Hz, J=9.7Hz), 3.77(1H, m), 3.92(1H, dt, J=7.3Hz, J=9.8Hz), 4.58(1H, t, J=3.9Hz), 7.19(2H, d, J=8.3Hz), 7.42(2H, d, J=8.3Hz)

IR: 3273, 1655, 1599, 1033 cm⁻¹

 $MS (EI) : 333(M^{+})$

エチレングリコールジメチルエーテル(120m1)に上記化合物(7.0g)とカリウムーt-ブトキシド(5.18g)を加え、30分間 60 で攪拌した。これにヨウ化メチル(16.39g)のエチレングリコールジメチルエーテル(4m1)溶液を滴下した。1 時間 60 でで攪拌した後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:7)にて精製すると、標記化合物(5.95g)を得た。

Rf値:0.23(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:5)

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.83(3H, t, J=6.8Hz), 1.17-1.26(6H, m), 1.42-1.60(4H, m), 1.63-1.90 (4H, m), 2.04(2H, t, J=6.4Hz), 3.47(2H, t, J=6.4Hz), 3.47(2H, dt, J=7.3H z, J=9.7Hz), 3.77(1H, m), 3.92(1H, dt, J=7.3Hz, J=9.8Hz), 4.58 (1H, t, J=3.9Hz), 7.19(2H, d, J=8.3Hz), 7.42(2H, d, J=8.3Hz)

IR: 3273, 1655, 1599, 1033 cm⁻¹

 $MS (E I) : 333(M^{+})$

(4) $2 - (4 - (N - N^2 + N - N - y + N^2 + N^2))$ $2 - (4 - (N - N^2 + N - N - y + N^2))$ $2 - (4 - (N - N^2 + N - N - y + N^2))$ $2 - (4 - (N - N^2 + N - N - y + N^2))$ $2 - (4 - (N - N^2 + N - N - y + N^2))$ $2 - (4 - (N - N^2 + N - N - y + N^2))$ $2 - (4 - (N - N^2 + N - N - y + N - y + N^2))$ $2 - (4 - (N - N^2 + N - N - y + N - y + N^2))$ $2 - (4 - (N - N^2 + N - N - y + N - y + N^2))$ $2 - (4 - (N - N^2 + N - N - y + N - y + N - y + N - y + N^2))$ $2 - (N - N^2 + N - N - y +$

上記化合物 (5.95g) のテトラヒドロフラン (90m1) 溶液を 5 \mathbb{C} に冷却し、これにジボランーテトラヒドロフラン錯体 (テトラヒドロフラン 1 M溶液: 32.2m1) を加え、5 \mathbb{C} $\mathbb{$

た後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:7)にて精製すると、標記化合物(3.6g)を得た。

Rf値: 0. 49 (酢酸エチル: n-ヘキサン=1:2)

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.88(3H, t, J=7.3Hz), 1.22-1.40(8H, m), 1.42-1.62(8H, m), 1.68-1.84 (2H, m), 2.81(2H, t, J=7.3Hz), 2.89(3H, s), 3.26(2H, t, J=7.8Hz),

3.46(1H, m), 3.57(1H, dt, J=7.4Hz, J=7.8Hz), 3.81(1H, m), 3.89(1H,

dt, J=7.3H z, J=7.8Hz), 4.60(1H, t, J=3.0Hz), 6.63(2H, d, J=8.8Hz),

7.08(2H, d, J=8.8Hz)

IR: 1616, 1365, 1030 cm⁻¹

 $MS (E I) : 333(M^{+})$

(5) $2 - (4 - (N - \gamma T + N - \gamma T +$

上記化合物(3.36g)のメタノール(60m1)溶液にpートルエンスルホン酸(3.10g)を加え、室温3時間攪拌した。トリエチルアミン(3m1)を加えた後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:12)にて精製すると、標記化合物(3.22g)を得た。

Rf値: 0. 31 (メタノール: クロロホルム=1:9)

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.88(3H, t, J=6.9Hz). 1.22-1.38(10H, m). 2.77(2H, t, J=6.4Hz). 2.90 (3H, s). 3.27(2H, t, J=7.4Hz.). 3.80(1H, t, J=6.4Hz). 6.66(2H, d, J=8.7Hz). 7.08(2H, d, J=8.7Hz)

IR: 3368, 1369 cm⁻¹

 $MS (E I) : 249(M^{+})$

(6) $2 - (4 - (N - N^2 + N - N - y + N^2 + N^2$

上記化合物 (3.65g) のテトラヒドロフラン (60m1) 溶液にトリエチ

ルアミン(2.22g)を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロライド(3.01g)を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:5)にて精製すると、標記化合物(4.02g)を得た。

Rf値: 0. 56 (酢酸エチル: $n-\Delta$ キサン=1:5)

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

- 0.88(3H, t, J=6.4Hz), 1.24-1.29(10H, m), 2.84(3H, s), 2.90(3H, s),
- 2. 96(2H, t, J=6.8Hz), 3. 27(2H, t, J=7.3Hz), 4. 36(2H, t, J=6.9Hz),
- 6. 64(2H, d. J=8.3Hz), 7. 07(2H, d. J=8.3Hz)
- (7) $2 (4 (N \gamma T + N \gamma T +$

上記化合物(4.00g)の2-ブタノン(200m1)溶液にヨウ化ナトリウム(3.66g)を加え、2時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒:酢酸エチル: (2.58g)を油状物として得た。

Rf値:0.78(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₈) δ :

0.88(3H, t. J=7.3Hz), 1.22-1.40(10H, m), 2.90(2H, s), 3.07(2H, t, J=7.8Hz), 3.63(2H, t. J=5.9Hz), 3.65(2H, t. J=7.3Hz), 6.62(2H, d, J=8.3Hz), 7.04(2H, d, J=8.3Hz)

IR: 1614. 1521. 1371. 804 cm⁻¹

 $MS (E I) : 359(M^{+})$

(8) $\Im x + h = 2 - r + r + r + 2 - (4 - (N - N) + h - N - x + h - r + 1)$ $\Im x + h = 2 - r + r + 1$ $\Im x + h = 1$

アセトアミドマロン酸ジエチル(4.63g)に窒素気流下、ナトリウムエトキシド(1.54g)の無水エタノール(18m1)溶液を滴下し、60℃で30分間攪拌した。次に、上記化合物(18g)のテトラヒドロフラン(7m1)溶液を滴下し、60℃で6時間攪拌する。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:2)にて精製すると、標記化合物(1.92g)を油状物として得た。

R f 値: 0. 4 9 (酢酸エチル: $n- \triangle + \forall \lambda = 1:2$)

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.88(3H, t, J=6.8Hz), 1.23-1.29(10H, m), 1.24(6H, t, J=7.4Hz), 1.99
(3H, s), 2.38(2H, m), 2.63(2H, m), 2.88(3H, s), 3.25(2H, t, J=7,3Hz),
4.21(4H, q, J=7.4Hz), 6.60(2H, d, J=8.3Hz), 6.76(1H, br.s), 6.99(2H, d, J=8.3Hz)

IR: 3285, 1739, 1682, 1616, 1371 cm⁻¹

 $MS (E I) : 448(M^{+})$

(9) 1, $3 - \mathcal{I}$ $- \mathcal{I}$ -

水素化アルミニウムリチウム(0.49g)の無水テトラヒドロフラン溶液(35ml)に、窒素気流下、上記化合物(1.92g)の無水テトラヒドロフラン溶液(20ml)を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え生成する水酸化アルミニウムを濾別後、溶媒を留去し、残渣にピリジン(84ml)を加えた。氷冷下、無水酢酸(19ml)を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル)にて精製すると、標記化合物(1.2g)を油状物として得た。

融点=88~94℃

Rf値: 0. 50 (クロロホルム: メタノール=9:1)

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

- 0.88(3H, t, J=6.9Hz), 1.24-1.29(10H, m), 1.94(3H, s), 2.08(6H, s),
- 2.15(2H, m), 2.51(2H, m), 2.89(3H, s), 3.26(2H, t, J=7.8Hz), 4.36(4H,
- s). 5.60(1H, br.s), 6.63(2H, d, J=8.3Hz), 7.03(2H, d, J=8.3Hz)

IR: 3314, 1739, 1651, 1616, 1386 cm⁻¹

 $MS (EI) : 448(M^{+})$

(10) $2-r = 1 - 2 - (2 - (4 - (N- \chi \tau + N - \chi \tau + \chi \tau$

上記化合物(1.20g)のメタノール(18m1)ーテトラヒドロフラン(18m1)溶液に水酸化リチウム(1.01g)の水溶液(12m1)を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、酢酸エチルにて再結晶した。得られた結晶のテトラヒドロフラン(7m1)ーメタノール(7m1)溶液に1M塩酸/エーテル溶液(14m1)を加えた。溶媒を留去し、析出した結晶を酢酸エチルにて再結晶することによって、標記化合物(0.11g)を得た。

融点=128~129℃

Rf値:0.20(クロロホルム:メタノール=9:1)

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.84(3H, t, J=6.8Hz), 1.25-1.46(10H, m), 1.70-1.74(2H, m), 2.42-2.46 (2H, m), 2.81(3H, s), 3.23(2H, t, J=7.4Hz), 3.49(4H, d, J=5.3Hz),

5, 35 (2H, t, J=4.9Hz), 6, 59(2H, d, J=8.3Hz), 6, 97(2H, d, J=8.3Hz)

IR: 3277, 1610, 1514, 1248 cm⁻¹

 $MS (E I) : 322(M^{+})$

元素分析值 計算值 C;59.13, H;9.92, N;72.26(1.5H₂0)

分析值 C:59.23, H:9.39, N:7.14

実施例283:2-アミノー2-〔2-(4-ヘプタノイルアミノフェニル)エ

チル] -1、3-プロパンジオール

(1) $2 - (4 - \wedge 79) + (4 - \wedge 7$

テトラヒドロフラン (300ml) に2-(p-アミノフェニル) エチルアルコール (13.8g) とトリエチルアミン (10.8g) を加え、氷冷下30分間攪拌した。これに塩化ヘプタノイル (15g) を滴下し、氷冷下30分間攪拌した。さらに、室温で3時間攪拌した後、反応溶液を、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣について酢酸エチルーイソプロピルアルコールで再結晶することにより、標記化合物 (13.15g) を得た。

融点=105~110℃

R f 値: 0. 41 (酢酸エチル: $n-\Lambda$ キサン=1:2→1:1)

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.89(3H, t, J=6.8Hz), 1.31-1.42(8H, m), 1.70(2H, tt, J=7.3Hz,

J=7.8Hz). 2.35(2H. t. J=7.3Hz). 2.83(2H. t. J=6.4Hz). 3.84(2H. dd.

J=6.3Hz. J=5.8Hz), 7.12(1H. br.s), 7.18(2H. d. J=8.3Hz), 7.45(2H. d. J=8.3Hz)

IR: 3302, 1660, 1593, 1412 cm⁻¹

 $MS (E I) : 249(M^{+}1)$

元素分析值 計算值 C;70.97, H;9.33, N;5.52 分析值 C:71.30, H:9.26, N:5.66

(2) 2 - (4 - ヘプタノイルアミノフェニル) エチルメタンスルホネート

上記化合物(6.00g)のテトラヒドロフラン(100m1)にトリエチルアミン(3.67g)を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロライド(5.00g)を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:1)にて精製すると、標記化合物(6.02g)を得た。

融点=103~105℃

Rf値:0.56(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:5)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.89(3H, t. J=6.4Hz), 1.22-1.40(6H, m), 1.72(2H, t, J=7.3Hz), 2.35

(2H. t, J=7.3Hz). 2.87(3H. s). 3.02(2H. t, J=7.3Hz), 4.39(2H. t.

J=6. 4Hz), 7.13(1H, br.s), 7.19(2H, d, J=8.3Hz), 7.48(2H, d, J=8.3Hz)

IR: 3307. 1659. 1337 cm⁻¹

 $MS (E I) : 327(M^{+})$

元素分析值 計算值 C:70.97, H:9.33, N:5.52

分析值 C:71.30, H:9.26, N:5.66

(3) $2 - (4 - \gamma^2 9) + (4 - \gamma$

上記化合物(6.02g)の2-ブタノン(300m1)溶液にヨウ化ナトリウム(5.51g)を加え、2時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル: $^{+}$ ペキサン=1:5)にて精製すると、標記化合物(5.31g)を油状物として得た。

融点=82~86℃

R f 値: 0. 33 (酢酸エチル: n-ヘキサン=1:5)

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.87(3H, t, J=6.9Hz), 1.21-1.40(6H, m), 1.70(2H, t, J=7.3Hz), 2.32

(2H, t, J=7.3Hz), 3.12(2H, t, J=7.8Hz), 3.30(2H, t, J=7.4Hz), 7.05

(1H. br.s), 7.12(2H, d, J=8.3Hz), 7.44(2H, d, J=8.3Hz)

IR: 3450, 1660, 1595, 709 cm⁻¹

 $MS (E I) : 359(M^{+})$

元素分析值 計算值 C;50.15, H;6.17, N;3.96

分析値 C:50.11, H:6.06, N:3.96

(4) ジエチルー2-第3級プトキシカルボニルアミノー2-(4-ヘプタノイル

アミノフェニル) エチル マロネート

2-第3級プトキシカルボニルアミノマロン酸ジエチル(12.12g)に窒素気流下、ナトリウムエトキシド(3.19g)の無水エタノール(40m1)溶液を滴下し、50℃で30分間攪拌した。次に、上記化合物(5.31g)のテトラヒドロフラン(20m1)溶液を滴下し、60℃で5時間攪拌する。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:7)にて精製すると、標記化合物(4.29g)を得た。

Rf値:0.49(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:2)

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.82(3H, t, J=6.9Hz), 1.18(6H, t, J=6.8Hz), 1.21-1.40(6H, m), 1.37

(9H. s), 1,64(2H, t, J=7.4Hz), 2,27(2H, t, J=7.3Hz), 2,42(2H, m),

2.51(2H, m), 4.05-4.25(4H, m), 5.92(1H, br.s), 7.00(1H, br.s), 7.03

(2H, d, J=8.3Hz), 7.33(2H, d, J=8.3Hz)

IR : 3319, 1739, 1772, 1666 cm⁻¹

 $MS (E I) : 506(M^{+})$

(5) 1, 3 -プロパンジイルー 2 -第 3 級プトキシカルボニルアミノー 2 - (2 - (4 - ヘプタノイルアミノフェニル) エチル] イリデンジアセテート

窒素気流下、上記化合物 (4.29g) のメタノール溶液に水素化ホウ素ナトリウム (0.32g) を加え残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒:酢酸エチル: (0.56g) を油状物として得た。

Rf値:0.31(酢酸:n-ヘキサン=2:1)

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.89(3H, t, J=6.8Hz), 1.21-1.46(10H, m), 1.45(9H, s), 1.70-1.90(4H,

m), 2.34(2H, t, J=7.3Hz), 2.59(2H, t, J=8.7Hz), 3.61-3.64(2H, m),

3.85-3.89(2H, m), 5.03(1H, br.s), 7.13(2H, d, J=8.3Hz), 7.42(2H, d,

J=8.3Hz)

IR: 3310, 1668, 1602 cm⁻¹

 $MS (E I) : 422(M^{+})$

(6) $2-r \le J-2-(2-(4-n)^2 + J^2 + J$

上記化合物(0.56g)のトリフルオロ酢酸(4m1)溶液を、氷冷下4時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチル(110m1)を加え、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、メタノールー酢酸エチルにて再結晶することによって、標記化合物(0.

14g)を白色結晶として得た。

融点=133~135℃

Rf値: 0. 47 (クロロホルム: メタノール=5:1)

 $^{1}H-NMR (DMSO-d_{6})\delta$:

0.85(3H, t. J=6.4Hz). 1.26-1.57(12H, m), 2.25(2H, t. J=3.9Hz), 3.17-3.25(4H, m), 4.43(2H, t. J=4.9Hz), 7.07(2H, d. J=8.8Hz), 7.45(2H, d. J=8.7Hz), 9.73(1H, br.s),

IR: 3317, 1653, 1601 cm⁻¹

 $MS (E I) : 322(M^{+})$

元素分析值 計算值 C:67.05, H:9.38, N:8.69 (1.5H₂0)

分析值 C:66.95, H:9.08, N:8.25

実施例284:2-アミノー2-(2-(4-オクチルフェニル) エチル)-1, 3-プロパンジオール

(1) 2-xトキシカルボニルー4-(4-x)クチルフェニル)酪酸エチルナトリウム(2. 67g)を無水x9ノール(100m1)に溶解し、マロン酸ジエチル(18.6g)を27~30℃にて3分間滴下後、40℃で40分攪拌した。さらに、反応液に2-(4-x)7・ルフェニル)エチルヨーダイド(40g)を44~45℃にて10分間で滴下し、50℃、1時間還流し、1.5時間加熱攪拌した。反応液を冷却し、溶媒を減圧留去した後、水を加え、酢酸エチ

ルで抽出した。抽出液を水洗し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去し、 シリカゲルカラムクロマトに付し、標記化合物28.8gを得た。

IR: 2920, 2850, 1745, 1725, 1240, 1140, 1040 cm⁻¹

(2) 2-アミノ-2-エトキシカルボニル-4-(4-オクチルフェニル) 酪酸 エチル

乾燥ジメチルホルムアミド(30m1)に60%水素化ナトリウム(0.38g)を懸濁させ、2-エトキシカルボニル-4-(4-オクチルフェニル)酪酸エチル(3.0g)を加えた後、室温にて2時間攪拌した。さらに、O-(2,4-ジニトロフェニル)ヒドロキシルアミン(1.14g)を加え、室温にて5時間攪拌した後、冷水にあけ、トルエンにて抽出した。塩化ナトリウム水にて洗浄後、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を減圧留去して、標記化合物3gを得た。

IR: 3380, 3320, 2930, 2850, 1730, 1180 cm⁻¹

(3) 2-アミノー2-〔2-(4-オクチルフェニル) エチル〕-1,3-プロ パンジオール

水素化ホウ素ナトリウム (0.60g) および臭化リチウム (1.66g) のエタノール (17m1) 懸濁液を室温にて25 分間攪拌した。さらに、2-r ミノー2-xトキシカルボニルー4-(4-x) クチルフェニル)酪酸エチル (1.24g) を 3 分間にて滴下し、室温にて5 時間攪拌した。反応液に水40m1 を加え、40 分間攪拌し、析出した結晶を濾取し、乾燥すると、標記化合物 0.68g を得た。融点:125~126 °C。標記化合物を塩酸エタノール液にて処理すると、対応する塩酸塩を得る。

実施例 285:2-rミノー 2-(4-(7-オクテニルオキシ)) フェニル ル 3-プロパンジオール

(1) $2 - (4 - (7 - \pi) - \pi)$

2-(4-ヒドロキシフェニル) エチルアルコール (8.68g) の無水エタ ノール溶液 (240ml) に、ナトリウムエトキシド (4.98g) を加え、5 0 \mathbb{C} $\mathbb{C$

ラヒドロフラン溶液を滴下し、50℃で6時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:5)にて精製すると、標記化合物(10.76g)を油状物として得た。

'H-NMR (DMSO):

1.35 (6H, s), 1.50~2.16 (4H, m), 2.62 (2H, t, J=6Hz), 3.41~3.65 (2H, m), 3.88 (2H, t, J=6Hz), 4.63 (1H, t, J=5Hz), 4.95 (2H, t×t, J=7Hz, 2Hz), 5.66 ~5.96 (1H, m), 6.74 (2H, d, J=9Hz), 7.04 (2H, d, J=9Hz)

IR ν NEAT_{max}: 3445, 2251, 1028, 823, 761 cm⁻¹ MS 248 (M⁺)

(2) 2-〔4-(7-オクテニルオキシ)フェニル〕エチル ヨーダイド 上記化合物(10.76g)のジクロロメタン溶液(100m1)に、トリエチルアミン(7.25m1)を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロライド(3.69m1)を滴下し、室温にて1時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにで乾燥後、溶媒留去し、残渣の2-ブタノン溶液(200m1)にヨウ化ナトリウム(7.78g)を加え、5時間加熱還流した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにで乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製すると、標記化合物(13.72g)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

1.53 (6H. s). 1.68 \sim 2.07 (4H. m). 2.96 \sim 3.18 (4H. m). 3.90 (2H. t. J=6Hz). 4.92 (2H. m). 5.56 \sim 5.96 (1H. m). 6.76 (2H. d. J_H=9Hz). 7.03 (2H. d. J_H=9Hz)

 $IR \nu NEAT_{max}$: 2930, 1511, 1246 cm⁻¹

 $MS 358 (M^{+})$

(3) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-(7-オクテニルオキシ) フェニル) エチル マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル(16.60g)の無水エタノール溶液(100m1)に、ナトリウムエトキシド(5.72g)を加え、65℃で30分攪拌した。次に上記化合物(13.69g)の無水エタノール溶液(100m1)を滴下し、65℃で3時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:2)にて精製すると、標記化合物(4.60g)を得た。

融点=50~53℃

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

1.25 (8H, t), 1.30 ~1.49 (6H, m), 1.72~1.79 (2H, m), 2.00 (3H, s), 2.63 ~2.67 (2H, m), 3.91 (2H, t, J=6Hz), 4.15~4.25 (4H, m), 4.92~5.03 (2H, m), 5.76~5.86 (1H, m), 6.79 (2H, d, J=8Hz), 7.04 (2H, d, J=8Hz)

I R ν_{max} : 3251, 2931, 1743, 1515, 1247, 1186 cm⁻¹ MS 4 4 7 (M⁺)

(4) $2-rv+r \le i-2-(2-(4-(7-x)r+y)) = 1$, 3-rv+y=1, 3-rv+y=1,

水素化アルミニウムリチウム(1.52g)の無水テトラヒドロフラン溶液(50m1)に氷冷下、上記化合物(4.47g)の無水テトラヒドロフラン溶液(70m1)を滴下した。室温に戻し、3時間攪拌した。氷冷下、飽和硫酸ナトリウム水溶液を滴下し、水素化アルミニウムリチウムを分解後、濾別し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣にピリジン(19.8m1)を加える。氷冷下、無水酢酸(18.4m1)を加え、室温で一夜放置した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を7%塩酸、飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲ

ルクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:2)にて精製し、標記化合物(2,23g)を白色結晶として得た。

融点=88~90℃

 $MS 447 (M^{+})$

8 (2H. d. J=4Hz)

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

1.54~1.57 (8H. m). 1.76 (2H. m). 1.96 (3H. s). 2.03~2.09 (8H. m). 2.52~2.57 (2H. m). 3.92 (2H. t. J=6Hz). 4.34 (4H. s). 4.93~5.02 (2H. m). 5.64 (1H. s). 5.64 ~5.86 (1H. m). 6.81 (2H. d. J=4Hz). 7.0

I R ν : 3308, 1738, 1652, 1247, 1227 cm⁻¹

(5) $2-r \le J-2-\{2-(4-(7-x)2-1)(2-x)\}$ -1, $3-y^2-1$

上記化合物 (1.01g) のメタノール溶液 (20m1) に水酸化リチウム (0.84g) の水溶液 (20m1) を加え、2時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、酢酸エチルにて再結晶することにより、融点 $95\sim98$ \mathbb{C} の標記化合物 (0.32g) を得た。

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

1.36~1.48 (8H. m). 1.73~1.78 (2H. m). 2.06 (2H. q. J=8Hz). 2.59 (2H. t. J=8Hz). 3.56 (4H. q. J=12Hz). 3.91 (2H. q. J=8Hz). 4.93 ~ 5.02 (2H. m). 5.76~5.86 (1H. m). 6.82 (2H. d. J=10Hz). 7.09 (2H. t. J=10Hz)

I R ν : 3350, 2938, 1512, 1245, 1021 cm⁻¹

実施例286:2-アミノ-2-〔2- (4-オクチルオキシフェニル) エチル〕 -1、3-プロパンジオール塩酸塩

2-アセトアミド-2-{2-[4-(7-オクテニルオキシ)フェニル]エ

チル $\}$ - 1, 3 - プロパンジオール ジアセテート (1. 2 7 g) のエタノール 溶液 (30 m 1) に 10 %パラジウム炭素 (0. 1 g) を加え、水素雰囲気下常 温常圧で 6 時間攪拌した。触媒を濾別し、濾液を濃縮し、残渣を濾取し、標記化 合物 (1. 18 g) を得た。

融点=99~102℃

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.86 (3H, t, J=8Hz), 1.26 ~1.56 (12H, m), 1.94 (3H, s), 2.07 (6H, s), 2.12~2.17 (2H, m), 2.50~2.55 (2H, m), 3.89 (2H, t, J=6Hz), 4.32 (4H, s), 5.62 (1H, s), 6.79 (2H, d, J=8Hz), 7.06 (2H, d, J=8Hz)

IR ν : 3311, 2917, 1738, 1651, 1247 cm⁻¹

(2) 2-アミノー2-{2-(4-オクチルオキシフェニル)エチル}-1,3-プロパンジオール塩酸塩

上記化合物 (1.13g)のエタノール溶液 (20m1)に水酸化リチウム (0.94g)の水溶液 (20m1)を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をメタノール (10m1)に溶かし、1M塩酸のエーテル溶液 (10m1)を加える。析出する結晶を濾取し、表題化合物 (0.60g、65.2%)を得た。

融点=59~61℃

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.88 (3H, t, J=4Hz), 1.28 \sim 1.41 (12H, m), 1.73 \sim 1.75 (2H, m), 1.95 (2H, m), 2.60 (2H, s), 3.78 \sim 3.92 (6H, m), 6.80 (2H, m), 7.10 (2H, m)

IR ν : 3354, 1609, 1513, 1247

実施例287:2-アミノ-2-(13-フェニルトリデシル)-1,3-プロ パンジオール

(1) 12-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)ドデカノール

1, 12-ドデカンジオール(25g)をジクロロメタン(200ml)とテ

トラヒドロフラン(200m1)に溶解し、触媒量のパラトルエンスルホン酸と 3,4-ジヒドロー2H-ピラン(14m1)を加えて、室温で2時間放置した。トリエチルアミンで反応を止めて、溶媒を留去後、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:(15.46g)を無色油状物質として得た。

Rf:0.39(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1.28 (16H, m), 1.62 (10H, m), 3.65 (6H, m), 4.59 (1H, br.s)

IR (neat): 3417, 2927, 2854, 1034 cm⁻¹

 $MS (E I) : 285 (M^{+} - 1)$

ジメチルスルホキシド(11.3m1)のジクロロメタン溶液(85m1)に、-78 ℃で窒素雰囲気下、オキザリルクロリド(6.9m1)をゆっくり滴下した。20分間、-78 ℃で攪拌後、上記化合物(15.25g)のジクロロメタン130m1溶液を30分間かけて徐々に加えた。20分間、-78 ℃で攪拌後、トリエチルアミン(37m1)を加えた。150m1の水で反応を止めてクロロホルム150m1にて2回抽出後、乾燥、留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製して、標記化合物(13.54g)をやや黄色の油状物質として得た。

Rf:0.63(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1. 29 (14H, m), 1.58 (10H, m), 2.43 (2H, dt, J=2 & 6Hz), 3.26~4.20 (4H, m), 4.59 (1H, br.s), 9.79 (1H, t, J=2Hz)

IR (neat): 2929, 2855, 1727 cm^{-1}

 $MS (E I) : 284 (M^{+})$

(3) 1-フェニル-13-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) -1-トリ デセン

ベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド(19,44g)のテトラヒドロ

フラン(100m1)懸濁液に1.6Mブチルリチウムのヘキサン溶液(31m1)を氷冷下加えた。これに、上記化合物(13.54g)のテトラヒドロフラン30m1溶液を氷冷下滴下した。3時間攪拌後、反応液を濃縮し、200m1の氷水にあけた。酢酸エチル150m1にて2回抽出後、乾燥、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:9)にて精製して、標記化合物(2.60g)を得た。

Rf:0.66(酢酸エチル:ヘキサン=1:5)

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1.30 (14H, m), 1.58 (10H, m), 2.22 (2H, m), 3.60 & 3.80 (4H, 2m),

4.59 (1H, br.s), 6.19 \sim 6.53 (2H, m), 7.30 (5H, m)

IR (neat): 2927, 2854, 1466, 1034 cm⁻¹

 $MS (E I) : 358 (M^{+})$

(4) 13-フェニル-1-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)トリデカン上記化合物(2.63g)のエタノール80m1溶液に、10%パラジウム炭素(260mg)を加えて、水素雰囲気下、室温で3時間攪拌した。触媒をセライト濾過した後、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒:酢酸エチル:ヘキサン=1:9)にて精製して、標記化合物(2.67g)を無色油状物質として得た。

Rf:0.60(酢酸エチル:ヘキサン=1:5)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1.27 (18H. m). 1.60 (10H. m). 2.62 (2H. t. J=7Hz). 3.45 & 3.80 (4H.

2m), 4.59 (1H. br.s), 7.21 (5H. m)

IR (neat): 2927, 2854, 1453 cm⁻¹

 $MS (E I) : 360 (M^{+})$

(5) 13-フェニルトリデカノール

上記化合物(2.63g)と触媒量のp-トルエンスルホン酸のメタノール(30ml)およびテトラヒドロフラン(8ml)溶液を室温で一夜放置した。トリエチルアミン(0.5ml)を加えて、濃縮後、得られた残渣をシリカゲルカ

ラムクロマト(展開溶媒:酢酸エチル:ヘキサン=1:5)にて精製して、標記 化合物(1.78g)を白色結晶として得た。

融点=34~36℃

Rf:0.24(酢酸エチル:ヘキサン=1:5)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1.28 & 1.57 (23H, 2br.s), 2.62 (2H, t, J=7.5Hz), 3.65 (2H, t, J=6Hz), 7.23 (5H, m)

IR (KBr): 3344, 3259, 2918, 2848, 1468 cm⁻¹

 $MS (EI) : 276 (M^{+})$

(6) 13-フェニルトリデシルメタンスルホネート

上記化合物(1.73g)のジクロロメタン(30m1)溶液にトリエチルアミン(1.2m1)を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロリド(0.58m1)を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:5)にて精製すると、標記化合物(2.12g)を白色結晶として得た。融点=45~47℃

Rf:0.39(酢酸エチル:ヘキサン=1:1)

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3} /TMS) \delta$:

1.28 & 1.70 (22H. 2m), 2.62 (2H. t, J=7.5Hz), 3.01 (3H. s), 4.23 (2H.

t, J=6Hz), 7.22 (5H, m)

IR (KBr): 2920, 2851, 1474, 1344 cm⁻¹

 $MS (E I) : 354 (M^{+})$

元素分析值:計算值:C;67.75 H;9.67

分析値: C: 67. 70 H: 9. 48

(7) 13-フェニルトリテシルヨーダイド

上記化合物 (2. 12g) の2-ブタノン (60m1) 溶液にヨウ化ナトリウ

ム (1.165g)を加え、2時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル: (2.19g) を白色結晶として得た。

融点=19~22℃

Rf:0.88(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR$ (CDC 1 $_{3}$ /TMS) δ :

1.27 & 1.70 (22H, 2m), 2.61 (2H, t. J=7.5Hz), 3.19 (2H, t. J=6.5Hz), 7.21 (5H, m)

IR (KBr): 2917, 2851, 1472 cm^{-1}

 $MS (E I) : 386 (M^{+})$

元素分析值:計算值:C;75.63 H;9.91

分析值:C;75.22 H;9.92

(8) ジエチル 2-アセトアミド-2-(13-フェニルトリデシル) マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル(2.38g)に窒素気流下、ナトリウムエトキシド(0.764g)の無水エタノール(22m1)溶液を滴下し、65℃で30分間攪拌した。次に、上記化合物(2.11g)のテトラヒドロフラン(5m1)溶液を滴下し、65℃で6時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製すると、標記化合物(2.06g)を無色油状物質として得た。

Rf:0.41(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1.25 (20H. m). 1.58 (2H. m). 2.02 (3H. s). 2.30 (2H. m). 2.61 (2H. t. J=7.5Hz). 4.23 (4H. q. J=6Hz). 6.76 (1H. br.s). 7.21 (5H. m)

IR (neat): 3416, 3312, 2925, 2854, 1741, 1671 cm⁻¹ MS (EI): 4 7 5 (M⁺)

(9) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(13-フェニルトリデシル) プロパン

水素化アルミニウムリチウム(0.56g)の無水テトラヒドロフラン溶液(40m1)に、窒素気流下、上記化合物(1.90g)の無水テトラヒドロフラン溶液(20m1)を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え生成する水酸化アルミニウムを濾別後、溶媒を留去し、残渣にピリジン(8m1)を加える。氷冷下、無水酢酸(5m1)を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷下、5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル)にて精製すると、標記化合物(1.01g)を白色結晶として得た。

融点=42~45℃

Rf:0.24(酢酸エチル:ヘキサン=1:1)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1.26 & 1.61 (22H, 2m), 1.96 (3H, s), 2.08 (6H, s), 2.62 (2H, t,

J=7.5Hz), 4.30 (4H, s), 5.61 (1H, br.s), 7.21 (5H, m)

IR (KBr): 3295, 2926, 2854, 1748, 1660, 1553 cm⁻¹

 $MS (E I) : 475 (M^{+})$

元素分析值:計算值:C;70.70 H;9.54 N;2.94

分析值:C;70.96 H;9.52 N;2.96

(10) 2-アミノー2-(13-フェニルトリデシル)-1, 3-プロパンジオール・1/4水和物

上記化合物(0.90g)のメタノール(11.5ml)溶液に水酸化リチウム(0.88g)の水溶液(11.5ml)を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、酢酸エチルにて再結晶して、

·標記化合物(170mg)を白色結晶として得た。

融点=61~64℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1.27 & 1.60 (24H, 2m), 2.00 (4H, m), 2.62 (2H, t, J=7.5Hz), 3.50 (4H, m), 7.22 (5H, m)

IR (KBr): 3342, 3290, 3157, 2916, 2849, 1581, 1472 cm⁻¹

 $MS (E I) : 349 (M^{+})$

元素分析值:計算值:C;74.63 H;11.24 N;3.96

分析値: C: 74.88 H: 10.94 N: 3.92

実施例 288:2-7 = 2 - (4-(6-7) + 2) = 2 - (4-(6-7) + 2) + 2

(1) 6-フェニルヘキシルメタンスルホネート

6-フェニルへキサノール(5.0g)のジクロロメタン(140m1)溶液にトリエチルアミン(5.09m1)を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロリド(2.50m1)を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:2)にて精製すると、標記化合物(8.08g)を無色油状物質として得た。

Rf:0.45(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

- 1.15~1.95 (8H, m). 2.65 (2H, t. J=7.5Hz), 2.99 (3H, s), 4.22 (2H,
- t. J=6Hz), 7.22 (5H, m)

IR (neat): 3027, 2937, 2858, 1497 cm⁻¹

(2) 6-フェニルヘキシルヨーダイド

上記化合物 (7. 93g) の2-ブタノン (150m1) 溶液にヨウ化ナトリウム (5. 33g) を加え、2時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチル

にて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル: $^{+}$ ハキサン=1:19)にて精製すると、標記化合物(7.62g)を無色油状物として得た。

Rf:0.78(酢酸エチル:ヘキサン=1:5)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1. $20\sim2.00$ (8H, m). 2. 60 (2H, t, J=7.5Hz), 3. 17 (2H, t, J=6.5Hz), 7. 15 (5H, m)

IR (neat): 3026, 2930, 2855, 1496, 1453 cm⁻¹

 $MS (E I) : 288 (M^{+})$

(3) 2-〔4-(6-フェニルへキシルオキシ)フェニル〕エタノール エタノール (130m1)に2-(4-ヒドロキシフェニル)エタノール (3.97g)とナトリウムエトキシド (2.30g)を加え、30分間加熱還流した。これに上記化合物 (7.53g)のテトラヒドロフラン (30m1)溶液を滴下し、加熱還流下6時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製すると、標記化合物 (5.49g)を無色油状物質として得た。

Rf:0.50(酢酸エチル: \land キサン=1:2)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1.24~1.89 (8H, m), 2.59 (2H, t, J=7.5Hz), 2.76 (2H, t, J=5Hz), 3.76 (2H, t, J=6.5Hz), 3.89 (2H, t, J=5Hz), 6.76 (2H, d, J=8.5Hz), 7.06 (2H, d, J=8.5Hz), 7.13 (5H, m)

IR (neat): 3355, 2933, 2858, 1613, 1512 cm⁻¹

 $MS (E I) : 298 (M^{+})$

上記化合物(5.40g)のジクロロメタン(100m1)溶液にトリエチルアミン(3.3m1)を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロリド(1.7m1)を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:2)にて精製すると、標記化合物(6.99g)を無色油状物として得た。

Rf:0.39(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1.30~1.92 (8H, m), 2.75 (2H, t, J=7.5Hz), 2.81 (3H, s), 2.96 (2H, t, J=7Hz), 3.89 (2H, t, J=6Hz), 4.33 (2H, t, J=7Hz), 6.80 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.06 (2H, d, J=8.5Hz), 7.15 (5H, m)

IR (neat): 2936, 2858, 1513 cm⁻¹

 $MS (EI) : 376 (M^{+})$

(5) 2-(4-(6-フェニルへキシルオキシ)フェニル] エチルヨーダイド 上記化合物(6.88g)の2-ブタノン(180ml)溶液にヨウ化ナトリウム(3.29g)を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:9)にて精製すると、標記化合物(6.25g)を無色油状物として得た。

Rf:0.81(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1.18~1.92 (8H, m). 2.60 (2H, t. J=7.5Hz), 3.18 (4H, m), 3.90 (2H, t. J=6Hz), 6.75 (2H, d. J=8.5Hz), 7.06 (2H, d. J=8.5Hz), 7.10 (5H, m)

IR (neat): 2932, 2856, 1611, 1511 cm⁻¹

 $MS (E I) : 408 (M^{+})$

元素分析值:計算值:C;58.83 H;6.17

分析值:C;58.88 H;6.53

(6) $\Im x + \pi = 2 - \pi + \pi + \pi = 2 - \pi = 2$

アセトアミドマロン酸ジエチル(9.89g)に窒素気流下、ナトリウムエトキシド(3.20g)の無水エタノール(40m1)溶液を滴下し、65℃で30分間攪拌した。次に、上記化合物(6.20g)のテトラヒドロフラン(15m1)溶液を滴下し、65℃で6時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製すると、標記化合物(4.04g)を白色結晶として得た。

融点=53~55℃

Rf:0.18(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

1. 84 (6H, t, J=7Hz), 1. 11 \sim 1. 88 (10H, m), 1. 97 (3H, s), 2. 24 \sim 2. 76 (6H, m), 3. 87 (2H, t, J=6Hz), 4. 16 (4H, q, J=7Hz), 6. 70 (1H, s),

6.74 (2H, d, J=8.5Hz), 6.97 (2H, d, J=8.5Hz), 7.15 (5H, m)

IR (neat): 3233, 2933, 1747, 1639, 1511 cm⁻¹

 $MS (EI) : 4 9 7 (M^{+})$

元素分析值:計算值:C;70.00 H;7.90 N;2.81

分析值: C; 69.83 H; 7.91 N; 2.90

(7) 2-r+r+r+1, $3-3r+r+1-2-\{2-\{4-(6-r+1)-2-(4-r+1)-2-(4-(6-r+1)-2-(4-r+$

水素化アルミニウムリチウム(0.87g)の無水テトラヒドロフラン溶液(60ml)に、窒素気流下、上記化合物(3.79g)の無水テトラヒドロフラン溶液(10ml)を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え生成する水酸化アルミニウムを濾別後、溶媒を留去し、残渣にピリジン(15ml)を加える。氷冷下、無水酢酸(10ml)

を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル)にて精製すると、標記化合物(1.80g)を白色結晶として得た。

融点=68~70℃

Rf:0.66(酢酸エチル)

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3} /TMS) \delta$:

1.24~1.88 (8H. m). 1.94 (3H. s). 2.06 (6H. s). 2.10 (2H. m). 2.56 (4H. m). 3.88 (2H. t. J=7Hz). 4.30 (4H. s). 5.60 (1H. s). 6.72 (2H. d. J=8.5Hz). 7.02 (2H. d. J=8.5Hz). 7.13 (5H. m)

IR (KBr): 3319, 2934, 1739, 1652 cm⁻¹

 $MS (EI) : 497 (M^{+})$

元素分析值:計算值:C;70.00 H;7.90 N;2.81 分析值:C;70.34 H;7.93 N;2.86

上記化合物(1.75g)のメタノール(25m1)溶液に水酸化リチウム(1.33g)の水溶液(17m1)を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、酢酸エチルにて再結晶した。得られた結晶のメタノール(10m1)溶液に1M塩酸のエーテル溶液(10m1)を加える。溶媒を留去し、析出した結晶を酢酸エチルにて再結晶することによって、標記化合物(0.90g)を白色結晶として得た。

融点=89~91℃

Rf: 0. 41 (クロロホルム:メタノール:酢酸:水=70:20:6:4)
¹H-NMR (CDC1₃) δ:

1.33 (4H. m). 1.59 (6H. m). 1.91 (1H. br.s). 2.36 (1H. br.s). 2.55 (2H. t. J=7.8Hz). 3.72 (4H. m). 4.98 (1H. br.s). 6.66 (2H. d.

J=8.8Hz), 7.03 (2H, d, J=8.8Hz), 7.12 (3H, m), 7.22 (2H, m), 7.85 (1H, br.s)

IR (KBr): 3275, 3028, 2934, 2858, 1513 cm⁻¹

 $MS (E I) : 371 (M^{+})$

元素分析值:計算值:C;67.71 H;8.40 N;3.43

分析値: C; 67. 61 H; 8. 30 N: 3. 42

実施例289:2-アミノ-2-〔2-(4-ウンデシルオキシフェニル)エチ ル]-1,3-プロパンジオール

(1) 2 - $(4 - \dot{0})$

2-(4-ヒドロキシフェニル)エタノール(15.5g)、ウンデシルプロミド25m1およびナトリウムエトキシド(8.40g)のエタノール溶液(300m1)を5時間加熱還流した。溶媒留去後、水(200m1)と酢酸エチル(200m1)を加える。水層をさらに酢酸エチル200m1にて抽出した。合わせた抽出物を乾燥、濾過後、溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製して、標記化合物23.37gを白色結晶として得た。

融点=47~50℃

Rf:0.40(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.87 (3H, t, J=7.5Hz), 1.10 \sim 1.58 (16H, m), 1.87 (2H, m), 2.78 (2H, t, J=7.5Hz), 3.78 (2H, t, J=7Hz), 3.89 (2H, t, J=7Hz), 6.82 (2H, d, J=9Hz), 7.09 (2H, d, J=9Hz)

IR (KBr): 3250, 2919, 2850, 1513, 1251 cm⁻¹

 $MS (E I) : 2 9 2 (M^{+})$

(2) 2-(4-ウンデシルオキシフェニル) エチルメタンスルホネート

上記化合物(23.24g)のジクロロメタン溶液(400m1)にトリエチルアミン(14.4m1)を加えた。氷冷下、この混合物にメタンスルホニルクロリド(7.1m1)を加えて、室温で2時間攪拌後、200m1の氷水にあけ、

ジクロロメタン(200m1)で2回抽出した。抽出物を乾燥、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製して、標記化合物(28.07g)を白色結晶として得た。

融点=43~44℃

Rf:0.51(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

0.88 (3H, t. J=7.5Hz), 1.25 (16H, m), 1.75 (2H, m), 2.81 (3H, s),

2.96 (2H, t, J=7Hz), 3.90 (2H, t, J=6Hz), 4.35 (2H, t, J=7Hz), 6.75

(2H. d. J=9Hz), 7.05 (2H. d. J=9Hz)

IR (KBr): 2919, 2851, 1515, 1352 cm⁻¹

 $MS (EI) : 370 (M^{+})$

元素分析值:計算值:C;64.83 H;9.25

分析值:C:64.78 H;9.17

(3) 2-(4-ウンデシルオキシフェニル) エチルヨーダイド

上記化合物(27.95g)とヨウ化ナトリウム(13.00g)の2-ブタ ノン溶液(350m1)を3時間加熱遺流した。溶媒を留去後、水(200m1) を加え、酢酸エチル(200m1)にて2回抽出後、乾燥した。溶媒を留去して 得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル: ヘキサン= 1:19)にて精製して、標記化合物(26.45g)を白色結晶として得た。

融点=22~23℃

Rf:0.79(酢酸エチル:ヘキサン=1:5)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

0.88 (3H. t. J=7Hz), 1.30 (16H, m), 1.75 (2H, m), 2.90 \sim 3.40 (4H, m),

3.90 (2H, t, J=7Hz), 6.76 (2H, d, J=9Hz), 7.02 (2H, d, J=9Hz),

IR (KBr): 2920, 2852, 1609, 1509, 1247 cm⁻¹

 $MS (EI) : 402 (M^{+})$

(4) ジエチル2-アセトアミド-2- [2-(4-ウンデシルオキシフェニル) エチル] マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル(42.68g)に窒素気流下、ナトリウムエトキシド(13.37g)の無水エタノール(400m1)溶液を滴下し、65℃で30分間攪拌した。次に、上記化合物(26.35g)のテトラヒドロフラン(50m1)溶液を滴下し、65℃で6時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:5)にて精製すると、標記化合物(13.94g)を得た。

融点=63~65℃

Rf:0.24(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

0.86 (3H, t, J=7.1Hz), 1.24 (20H, m), 1.41 (2H, m), 1.73 (2H, m),

1.97 (3H, s), 2.39 (2H, m), 2.62 (2H, m), 3.89 (2H, t, J=6.3Hz), 4.1

8 (4H, m), 6.74 (1H, s), 6.77 (2H, d, J=8.3Hz), 7.02 (2H, d, J=8.3Hz)

IR (KBr): 3286, 2917, 2851, 1746, 1647, 1513 cm⁻¹

 $MS (E I) : 4 9 1 (M^{+})$

元素分析值:計算值:C;68.40 H;9.22 N;2.85

分析值:C;68.15 H;9.23 N;2.80

(5) 2-rv+r=1, 3-3rv+r=2-(2-(4-r))r+3+3-3rv+r=1

水素化アルミニウムリチウム(3.0g)の無水テトラヒドロフラン溶液(20m1)に、窒素気流下、上記化合物(13.02g)の無水テトラヒドロフラン溶液(60m1)を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え生成する水酸化アルミニウムを濾別後、溶媒を留去し、残渣にピリジン(40m1)を加える。氷冷下、無水酢酸(30m1)を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒:酢酸

エチル) にて精製すると、標記化合物 (7.18g) を白色結晶として得た。 融点=82~85℃

Rf:0.6(酢酸エチル)

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ /TMS) δ :

0.86 (3H, t. J=6.4Hz), 1.24 (14H, m), 1.41 (2H, m), 1.75 (2H, m).

1.94 (3H, s), 2.07 (6H, s), 2.14 (2H, m), 2.53 (2H, m), 3.89 (2H, t,

J=6.6Hz). 4.32 (4H. s). 5.62 (1H. s). 6.79 (2H. d. J=8.8Hz). 7.06

(2H. d. J=8.8Hz)

IR (KBr): 3314, 2918, 2851, 1737, 1653 cm⁻¹

 $MS (E I) : 491 (M^{+})$

元素分析值:計算值:C;68.40 H;9.22 N;2.85

分析值:C;68.36 H;9.19 N;2.85

(6) $2-r \le 1-2-(2-(4-y)r \ge 1) + (2-y) = 1$

3-プロパンジオール・塩酸塩

上記化合物(7.16g)のメタノール(70m1)溶液に水酸化リチウム(5.50g)の水溶液(70m1)を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、酢酸エチルにて再結晶した。得られた結晶のテトラヒドロフラン(20m1)ーメタノール(20m1)溶液に1M塩酸のエーテル溶液(30m1)を加える。溶媒を留去し、析出した結晶を酢酸エチルにて再結晶することによって、標記化合物(1.90g)を得た。

融点=88~91℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃ -CD₃OD/TMS) δ :

0.80 (3H, t, J=6.9Hz), 1.19 (14H, m), 1.36 (2H, m), 1.68 (2H, m).

1.85 (2H, m), 2.53 (2H, m), 3.65 (4H, m), 3.84 (2H, t, J=6.4Hz),

6. 74 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 04 (2H, d, J=8. 3Hz)

IR (KBr): 3274, 2921, 2852, 1613, 1513, 1247 cm⁻¹

 $MS (E I) : 365 (M^{+})$

元素分析值:計算值:C;65.73 H;10.03 N;3.48

分析值: C; 65.53 H; 9.82 N; 3.42

実施例290:2-アミノ-2-〔2-(4-ドデシルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール

(1) 2-(4-ドデカノイルフェニル) エチルアセテート

ジクロロエタン(400ml)に窒素気流下、塩化アルミニウム(48.2g)を加え、室温で攪拌した。次にフェネチルアセテート(39.6g)およびウンデカノイルクロリド(52.7g)を氷冷下滴下し、室温で一晩攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチルエーテルにて抽出した。エーテル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:20)にて精製すると、標記化合物(34.5g)を淡黄色結晶として得た。

融点=32~33℃

IR (neat) $_{max}$: 2921, 2852, 1738, 1686, 1240 cm⁻¹

(2) 2 - (4 - ドデシルフェニル) エタノール

上記化合物(34.5g)のトリフルオロ酢酸溶液(50m1)に氷冷下、トリエチルシラン(22.7m1)を加え、室温にて3時間攪拌した。溶媒留去し、氷水を注ぎ、冷飽和重炭酸ナトリウム溶液を徐々に加える。酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去した。残渣にメタノール(250m1)を加え、メタノール溶液とした。これにナトリウムメトキシド(10.2g)を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、氷水を注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を5%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、標記化合物(27.1g)を油状物として得る

Rf:0.21(酢酸エチル:ヘキサン=1:3)

(3) 2 - (4 - F) - (4 - F

上記化合物(27.1g)のジクロロメタン溶液(500m1)にトリエチルアミン(14.4m1)を加え、室温にて3時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、

ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム水溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。残渣に2-ブタノン(500ml)を加え、この溶液にヨウ化ナトリウム(12.2g)を加え、3時間加熱還流した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:20)にて精製すると、標記化合物(18.6g)を抽状物として得た。

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0. 37 (3H, t, J=6Hz), 0. 66 \sim 0. 86 (18H, m), 1. 05 \sim 1. 10 (2H, m), 2. 06 (2H, t, J=6Hz), 2. 63 (2H, t, J=4Hz), 2. 83 (2H, t, J=4Hz), 6. 60 (4H, dd, J=4Hz, 8Hz)

IR (neat) $_{mex}$: 2919, 1513, 1467, 1168 cm⁻¹

(4) ジエチル 2 - アセタミド - 2 - 〔2 - 〔4 - ドデシルフェニル〕エチル〕マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル(20.2g)に窒素気流下、ナトリウムエトキシド(6.3g)の無水エタノール溶液(100ml)を滴下し、65℃で30分攪拌した。次に、上記化合物(18.6g)の無水テトラヒドロフラン溶液(50ml)を滴下し、65℃で3時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製すると、標記化合物(8.9g)を得た。

融点=60~62℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.86 (3H, t, J=6Hz), 1.24 (6H, t, J=6Hz), 1.23~1.59 (18H, m), 1.54 ~1.59 (2H, m), 1.97 (3H, s), 2.45 (3H, t, J=6Hz), 2.54 (3H, t, J=6Hz), 2.67 (3H, t, J=6Hz), 4.15 ~4.24 (4H, m), 6.75 (1H, br.s), 7.06 (4H, dd, J=6Hz, 6Hz)

IR (KBr) max: 3253, 2920, 2850, 1747, 1644, 1517 cm⁻¹

(5) 2-r+r+r+r+1, 3-3r+r+1-2-(2-(4-r+r+1)-2-(2-(4-r+1)-2-(4-r+1)-2-(2-(4-r+1)-2-(4-

水素化アルミニウムリチウム(1.38g)の無水テトラヒドロフラン溶液(200ml)に、窒素気流下、上記化合物(8.9g)の無水テトラヒドロフラン溶液(50ml)を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え、生成する水酸化アルミニウムを濾別後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣にピリジン(28.7ml)を加える。氷冷下、無水酢酸(18.5ml)を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:2)にて精製し、標記化合物(2.5g)を白色結晶として得た。

融点=111~113℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.86 (3H, t, J=6Hz), 1.24 \sim 1.31 (18H, m), 1.53 \sim 1.58 (4H, m), 1.95 (3H, s), 2.09 (6H, s), 2.56 (2H, t, J=6Hz), 2.58 (2H, t, J=6Hz),

4.35 (4H. s), 5.62 (1H. br.s), 7.09 (4H. s)

IR (KBr): 3309, 2918, 2850, 1738, 1651 cm⁻¹

(6) $2-r \ge J-2-(2-(4-) デシルフェニル) エチル) -1, 3-プロパンジオール・塩酸塩$

上記化合物(2.5g)のメタノール溶液(25m1)に水酸化リチウム(1.7g)の水溶液(25m1)を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、26%塩酸-エタノール溶液を加え、攪拌した。溶媒を留去し、エタノールにて再結晶し、標記化合物(770mg)を白色結晶として得た。

 $^{1}H-NMR$ (DMSO) δ :

0.88 (3H, t. J=6Hz), 1.25 ~1.30 (18H, m), 1.52 ~1.58 (2H, m), 1.94 ~2.02 (2H, m), 2.56~2.60 (2H, m), 2.64~2.68 (2H, m), 3.81 (4H, dd, J=11, 26Hz), 4.79 (2H, br.s), 7.09 (4H, dd, J=6, 26Hz), 8.07 (3H, br.s) IR (KBr) : 2921, 2852, 1738, 1686, 1240 cm⁻¹

実施例 291:2- アミノー 2- 〔2- (2- オクチルフェニル〕エチル〕-1, 3- プロパンジオール

(1) $1 - (2 - \vec{J} D + \vec{J} D$

無水テトラヒドロフラン(10m1)に窒素気流下、マグネシウム片(6.56g)を加え、室温で攪拌した。次に、徐々に加熱しながら、1-ブロモヘプタン(48.4g)の無水テトラヒドロフラン溶液(200m1)を滴下し、40℃で1時間攪拌した。次に2-プロモベンズアルデヒド(25g)の無水テトラヒドロフラン溶液(100m1)を室温で滴下し、1時間攪拌した。反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:8)にて精製し、標記化合物(18.9g)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.85 (3H, t, J=6Hz), 1.24 \sim 1.58 (10H, m), 1.61 \sim 1.79 (2H, m), 5.05 (1H, m, J=4Hz), 7.08 \sim 7.12 (1H, m, J=6Hz), 7.29 \sim 7.31 (1H, m, J=6Hz), 7.50 \sim 7.54 (2H, m, J=4Hz)

IR ν (neat): 3350, 2927, 1466, 1023 cm⁻¹

(2) h = 2 - (1 - x) - x

上記化合物(2.85g)のベンゼン溶液(200m1)に五酸化二リン(7.1g)を加え、2時間加熱還流した。五酸化二リンを濾別後、溶媒留去し、残渣に氷水を加えた。酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:15)にて精製し、標記化合物(2.4g)を油状物として得た。

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.86 (3H. t, J=7Hz), 1.18 ~1.45 (6H, m), 1.46~1.55 (2H, m), 2.24 (2H, m, J=1Hz, 7Hz), 6.16 (1H, m, J=7Hz), 6.72 (1H, d, J=16Hz), 7.02 ~7.08 (1H, m), 7.19~7.33 (1H, m), 7.46~7.55 (2H, m)

IR ν (neat): 2957, 2855, 1466, 1023 cm⁻¹

(3) トランスー2-(1-オクテニル) ベンズアルデヒド

無水テトラヒドロフラン(10m1)に窒素気流下、マグネシウム片(3.74g)を加え、室温にて攪拌した。徐々に加熱しながら、上記化合物(37.4g)の無水テトラヒドロフラン(100m1)を滴下し、60℃で1.5時間加熱した。次にジメチルホルムアミド(11.5m1)の無水テトラヒドロフラン溶液(100m1)を室温で滴下し、一晩攪拌した。反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:15)にて精製し、標記化合物(26.7g)を油状物として得た。

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.88 (3H. t. J=6Hz). 1.22 \sim 1.38 (6H. m). 1.45 \sim 1.52 (2H. m). 2.24 \sim 2.36 (2H. m). 6.11 \sim 6.18 (1H. m). 7.15 (1H. d. J=18Hz). 7.33 \sim 7.37 (1H. m). 7.48 \sim 7.53 (2H. m). 7.58 (1H. d. J=4Hz). 10.31 (1H. s) I R ν (n e a t) : 2927. 2855. 1699. 1597 cm⁻¹

(4) 2-オクチルベンズアルデヒド

上記化合物(26.7g)のメタノール溶液(200m1)に10%パラジウム炭素(1g)のメタノール溶液(20m1)を加え、水素気流下、常温常圧にて14時間攪拌し、接触還元した。10%パラジウム炭素を濾別後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:20)にて精製し、標記化合物(22g)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1_a) δ :

0.86 (3H. t. J=7Hz). 1.25 \sim 1.38 (10H. m), 1.54 \sim 1.63 (2H. m), 3.00

(2H. t. J=7Hz), 7.24 \sim 7.26 (1H. m), 7.31 \sim 7.35 (1H. m), 7.46 \sim 7.50 (1H. m), 7.80 \sim 7.83 (1H. m), 10.28 (1H. s)

IR ν (neat): 3335, 2926, 1701, 1601 cm⁻¹

(5) エチル (2-オクチルフェニル) アセテート

上記化合物(22g)のジオキサン溶液(100m1)に室温で、メチルメチルスルフィニルメチルスルフィド(12.4g)およびトリトンB(9.16m1)を加え、2時間加熱還流した。溶媒を留去し、酢酸エチルを加え、飽和食塩水にて酢酸エチル層を洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去し、残渣にエタノール(200m1)を加えた。このものに、26%塩酸-エタノール溶液を加え、室温で30分間攪拌した。溶媒を留去し、残渣に氷水を注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で乾燥し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:30)にて精製し、標記化合物(20.2g)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₈) δ :

0.86 (3H. t, J=5Hz), 1.19 ~1.38 (10H. m), 1.24 (3H. t, J=5Hz), 1.49 ~1.62 (2H. m), 2.59 (2H. t, J=6Hz), 3.85 (2H. s), 4.13 (2H. q, J=5Hz), 7.10~7.35 (4H. m)

(6) 2-(2-オクチルフェニル) エチルアルコール

水素化アルミニウムリチウム(3.04g)の無水テトラヒドロフラン溶液(200m1)に窒素気流下、上記化合物(20.2g)の無水テトラヒドロフラン溶液(50m1)を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え、生成する水酸化アルミニウムを濾別後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:30)にて精製し、標記化合物(10.2g)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.87 (3H. t. J=6Hz), 1.21 \sim 1.46 (10H. m), 1.47 \sim 1.62 (2H. m), 2.61 (2H. t. J=6Hz), 2.96 (3H. t. J=6Hz), 3.82 (2H. dd, J=6Hz, 12Hz).

7.14~7.24 (4H. m)

IR ν (neat): 3335, 2926, 2854, 1467 cm⁻¹

(7) 2-(2-オクチルフェニル) エチルメタンスルホネート

上記化合物(10.2g)のジクロロメタン溶液(250m1)に、トリエチルアミン(7.37m1)を加え氷冷した。これにメタンスルホニルクロリド(6.04g)を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム水溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:8)にて精製し、標記化合物(13.4g)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₈) δ :

0.86 (3H. t, J=6Hz). 1.22 \sim 1.41 (10H, m). 1.51 \sim 1.59 (2H, m). 2.60 (2H, t. J=6Hz). 2.84 (3H, s). 3.09 (2H, t. J=6Hz). 4.38 (2H, t. J=6Hz). 7.10 \sim 7.20 (4H, m)

IR (neat): 2929, 1467, 1357, 1174 cm⁻¹

(8) 2-(2-オクチルフェニル) エチルヨーダイド

上記化合物(13.4g)の2-ブタノン溶液(300m1)に、ヨウ化ナトリウム(7.7g)を加え、2時間加熱還流した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:30)にて精製し、標記化合物(11.9g)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₈) δ :

0.87 (3H. t. J=6Hz). 1.18 \sim 1.74 (10H. m). 1.50 \sim 1.59 (2H. m). 2.57 (2H. t. J=6Hz). 3.18 (2H. t. J=6Hz). 3.28 (2H. t. J=6Hz). 7.10 \sim 7.25 (4H. m)

IR (neat): 2923, 2854, 1490, 1468 cm⁻¹

(9) ジエチル 2-アセトアミド-2- [2-(2-オクチルフェニル) エチル] マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル(20.4g)に窒素気流下、ナトリウムエトキシド(6.39g)の無水エタノール溶液(50m1)を滴下し、65℃で1.5時間攪拌した。次に、上記化合物(10.8g)の無水テトラヒドロフラン溶液を滴下し、7時間加熱還流した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製し、標記化合物(5.8g)を白色結晶として得た。

融点=37~38℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.86 (3H. t, J=6Hz), 1.21 ~1.36 (10H. m), 1.25 (6H. t, J=6Hz), 1.46 ~1.57 (2H. m), 2.03 (3H. s), 2.38~2.47 (2H. m), 2.51 (2H. t, J=6Hz), 2.55~2.63 (2H. m. J=6Hz), 4.16 ~4.41 (4H. m), 6.82 (2H. br.s), 7.0 5 ~7.15 (4H. m)

IR(KBr): 3415, 2977, 2855, 1741, 1683, 1492 cm⁻¹
(10) 2-アセトアミドー1, 3-ジアセトキシー2-(2-オクチルフェニル) エチル) プロパン

水素化アルミニウムリチウム(0.76g)の無水テトラヒドロフラン溶液(200ml)に窒素気流下、上記化合物(4.3g)の無水テトラヒドロフラン溶液(50ml)を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え、生成する水酸化アルミニウムを濾別後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣にピリジン(10ml)を加えた。次に無水酢酸(13ml)を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)にて精製し、標記化合物(2.2g)を油状物で得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.86 (3H, t, J=6Hz), 1.21 \sim 1.38 (12H, m), 1.47 \sim 1.58 (2H, m), 1.97

(3H, s). 2.08 (6H, s). 2.56 (2H, t, J=6Hz). 2.58 (2H, t, J=6Hz). 4.35 (4H, s), 5.66 (1H, br.s), 7.09 ~7.13 (4H, m)

IR (neat): 3295, 2927, 1747, 1660, 1256 cm⁻¹

(1) 2-アミノー2-〔2-(2-オクチルフェニル)エチル〕-1,3-プロパンジオール・塩酸塩

上記化合物(2.2g)のメタノール溶液(20m1)に水酸化リチウム(1.7g)の水溶液(20m1)を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣に26%塩酸-エタノール溶液を加え、溶媒留去し、エタノールから再結晶することにより標記化合物(800mg)の塩酸塩を得た。

融点=168~170℃

 $^{1}H-NMR$ (DMSO) δ :

0.85 (3H. t. J=7Hz). 1.22 ~1.37 (10H. m), 1.43 ~1.54 (2H. m), 1.68 ~1.78 (2H. m), 2.52~2.63 (4H. m), 3.49~3.59 (4H. m), 5.40 (2H. t. J=4Hz), 7.05~7.17 (4H. m), 7.89 (3H. br.s)

IRν(KBr): 3385, 3272, 2925, 1519, 1069 cm⁻¹ 実施例292:2-アミノ-2-(4-オクチルチオベンジル)-1, 3-プロ パンジオール・塩酸塩・1/2水和物

(1) 4 - (x + y + y + z) = (1) +

イソプロピルアルコール(50ml)に水素化ホウ素ナトリウム(3.78g)を加え、氷冷下攪拌した。これに4-(メチルチオ)ベンズアルデヒド(15g)を滴下し、室温で30分間攪拌した。溶媒留去後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をヘキサン-酢酸エチルから再結晶し、標記化合物(15g)を白色結晶として得た。

融点=41~43℃

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

2.40 (3H. s). 4.43 (2H. s), 7.10 (4H. s), 3.36 (1H. br.s)

· 元素分析値(C₈H₁₀OS) :計算値: C, 62.30; H, 6.54

分析值: C, 61.90; H, 6.55

 $MS: 154 (M^{+})$

(2) 4-(メチルスルフィニル) ベンジルアルコール

上記化合物(15g)のクロロホルム溶液(100m1)に氷冷下メタクロロ過安息香酸(50%含有,35g)を加え、1時間加攪拌した。水酸化カルシウム(37g)を加え、室温にて1時間攪拌した後、不溶物を濾別し、濾液を飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;クロロホルム:メタノール=20:1)にて精製し、標記化合物(15.56g)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₈) δ :

2.73 (3H. s), 3.28 (1H. br.s), 4.45 (2H. s), 7.52 (4H. s)

IR (neat): 3364, 1409, 1303, 1148, 1031 cm⁻¹

元素分析値(C₈H₁₀O₂S):計算値: C, 56.45; H, 5.92

分析值: C, 56.51; H, 5.87

 $MS: 170 (M^{+})$

(3) 4-(メチルスルフィニル) ベンジルメタンスルホナート

上記化合物(13.88g)のジクロロメタン溶液(100m1)に氷冷下トリエチルアミン(14m1)を加えた。これにメタンスルフォニルクロリド(6.2m1)を滴下し、30分間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、0.1 N塩酸および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;クロロホルム:メタノール=10:1)にて精製し、標記化合物(15.38g)を白色結晶として得た。

融点:63~65℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₈) δ :

2.74 (3H. s), 3.0 (3H. s), 5.22 (2H. s), 7.52 (2H. d. J=8Hz), 7.63 (2H. d. J=8Hz)

IR (KBr): 3015, 1349, 1172, 1040, 951 cm⁻¹

元素分析値(C₈H₁₂O₄S₂):計算値: C, 43.53; H, 4.87

分析值: C, 43.51; H, 4.82

 $MS: 248 (M^{+})$

(4) 4-(メチルスルフィニル)ベンジルヨーダイド

上記化合物(8.25g)の2-ブタノン溶液(100m1)にヨウ化ナトリウム(7.5g)を加え、室温にて1時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;クロロホルム:メタノール=10:1)にて精製し、標記化合物(8.65g)を黄色結晶として得た。

融点:80~81℃

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₈) δ :

2.70 (3H, s), 4.42 (3H, s), 7.50 (4H, s)

IR (KBr): 1399, 1153, 1038, 837, 565 cm^{-1}

元素分析値(C₈H₈OSI):計算値: C, 34.30; H, 3.24

分析值: C, 34.17; H, 3.21

 $MS: 280 (M^{+})$

(5) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-メチルスルフィニルベンジル)マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル(13g)の無水エタノール溶液(200m1)に窒素気流下、ナトリウムエトキシド(4g)を加え、65℃で1時間攪拌した。次に、上記化合物(8.4g)の無水エタノール溶液を滴下し、65℃で1時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;クロロホルム:メタノール=20:1)にて精製し、標記化合物(8.2g)を結晶として得た。

融点:135~136℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₈) δ :

1. 28 (6H, t, J=7Hz), 2. 02 (3H, s), 2. 70 (3H, s), 3. 70 (2H, s), 4. 25 (4H, m), 6. 52 (1H, s), 7. 15 (2H, d, J=8Hz), 7. 53 (2H, d, J=8Hz)

IR (KBr): 3253, 2986, 1748, 1642, 1198, 1039 cm⁻¹

元素分析値(C₁₇H₂₃NO₆S):計算値: C, 55.27; H, 6.27; N, 3.79

分析值: C, 55.09; H, 6.25; N, 3.78

(6) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-メルカプトベンジル)マロネート上記化合物(6.22g)を氷冷下、トリフルオロ酢酸無水物(50m1)に加え、1時間攪拌した。トリフルオロ酢酸無水物を留去後、エタノール(100m1)とトリエチルアミン(100m1)を加え、室温にて1時間攪拌した。反応液を濃縮後、クロロホルム200m1を加え、飽和塩化アンモニウム水溶液にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;クロロホルム:メタノール=10:1)にて精製し、標記化合物(4.62g)を結晶として得た。

融点:125~128℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

1.27 (6H. t. J=7Hz). 2.00 (3H. s). 3.38 (1H. s). 3.57 (2H. s). 4.24 (4H. m). 6.50 (1H. s). 6.85 (2H. d. J=8Hz). 7.14 (2H. d. J=8Hz)

IR (KBr): 3398, 2986, 2547, 1736, 1665, 1212, 1018 cm⁻¹

元素分析値(C18H21NO5S):計算値: C, 56.62; H, 6.24; N, 4.13

分析值: C, 56.61; H, 6.20; N, 4.09

 $MS: 339 (M^{+})$

(7) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-オクチルチオベンジル) マロネート

上記化合物(1g)のジメチルホルムアミド溶液(10m1)に、1-ブロモオクタン(0.58g)と炭酸カリウム(0.5g)を加え、室温にて5時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得ら

れた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;クロロホルム:メタノール=25:1)にて精製し、標記化合物(1.16g)を結晶として得た。

融点:82~84℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.85 (3H, t, J=7Hz), 1.27 (14H, m), 1.40 (2H, quint, J=7Hz), 1.61 (2H, quint, J=7Hz), 2.01 (3H, s), 2.86 (2H, t, J=7Hz), 3.58 (2H, s), 4.25 (4H, m), 6.51 (1H, s), 6.89 (2H, d, J=8Hz), 7.17 (2H, d, J=8Hz) IR (KBr) : 3255, 2952, 1747, 1644, 1298, 1274, 1220 cm⁻¹

分析值: C, 63.33; H, 8.14; N, 3.06

元素分析値(C₂₄H₃₇NO₅S):計算値: C, 63.83; H, 8.26; N, 3.10

 $MS: 451 (M^{+})$

(8) 2-rセトアミドー2-(4-x)クチルチオベンジル) -1, 3-プロパンジオール

水素化アルミニウムリチウム(0.26g)の無水テトラヒドロフラン溶液(10m1)に氷冷下、上記化合物(1g)の無水テトラヒドロフラン溶液(10m1)を滴下した。氷冷下で1時間攪拌した後、室温で1時間攪拌した。氷冷下、飽和硫酸ナトリウム水溶液を滴下し、水素化アルミニウムリチウムを分解後、不溶物を濾別し、濾液を酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;クロロホルム:メタノール=10:1)にて精製し、標記化合物(0.6g)を結晶として得た。

融点:76~78℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.86 (3H. t, J=7Hz), 1.25 (8H. m), 1.40 (2H. quint, J=7Hz), 1.61 (2H. quint, J=7Hz), 1.99 (3H. s), 2.87 (2H. t, J=7Hz), 2.89 (2H. s), 3.50 (2H. m), 3.70 (2H. m), 3.73 (2H. m, -0H ×2), 5.79 (1H. s, -NH), 7.1 4 (2H. d, J=8Hz), 7.25 (2H. d, J=8Hz)

IR (KBr): 3422, 3347, 3192, 2942, 1654, 1550, 1055 cm^{-1}

· 元素分析値(C20H33NO3S):計算値: C. 65.36; H. 9.05; N. 3.81

分析值: C, 65.29; H, 9.11; N, 3.75

 $MS: 367 (M^{+})$

(9) 2-アミノー2-(4-オクチルチオベンジル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩

上記化合物(400mg)のメタノール溶液(5m1)に水酸化リチウム(380mg)の水溶液(5m1)を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去すると白色粉末が得られた。このものを、エタノール(2m1)に溶解し、26%塩酸-エタノール溶液(1m1)を加えた。溶媒を留去し、析出する結晶をヘキサン-酢酸エチルから再結晶することによって、標記化合物(80mg)を得た。

融点:100~102℃

 $^{1}H-NMR$ (CD₃ OD) δ :

0.76 (3H. t. J=7Hz). 1.16 (8H. m). 1.30 (2H. m). 1.53 (2H. quint. J=7Hz). 2.79 (2H. t. J=7Hz). 2.86 (2H. s). 3.43 (2H. m). 3.62 (3H. m). 7.06 (2H. d. J=8Hz). 7.15 (2H. d. J=8Hz)

IR (KBr): 3363, 3286, 2924, 1516, 1494, 1072 cm⁻¹

元素分析値(C18H31NO2S・HC1・1/2H2O):

計算值: C, 58.28; H, 8.97; N, 3.78

分析值: C. 58.44: H. 9.02: N. 3.68

実施例293:2-アミノ-2-〔2-(5-オクチル-2-チエニル) エチル〕 -1,3-プロパンジオール塩酸塩

00ml)に、3,4-ジヒドロー2H-ピラン(9.25g)とp-トルエンスルホン酸(2g)を加え、室温にて4時間攪拌した。溶媒を留去後、酢酸エチルを加え、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、

得られた油状物を蒸留により精製すると、標記化合物(13.52g)を油状物として得た。

沸点=107~108℃/1mmHg

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

1.50 (4H. m), 1.70 (1H. m), 1.82 (1H. m), 3.11 (2H. t, J=7Hz), 3.47 (1H. m), 3.60 (1H. dt, J=10, 7Hz), 3.79 (1H. m), 3.95 (1H. dt, J=10, 7Hz), 4.61 (1H. t, J=3.5Hz), 6.83 (1H. dd, J=1, 3.4Hz), 6.90 (1H. dd, J=3.4, 5.4Hz), 7.11 (1H. dd, J=1, 5.4Hz)

IR (neat): 2930, 1250, 1120, 1030, 870 cm^{-1}

元素分析值 C11H16O2S:計算值:C;62.23 H;7.60

分析值:C;62.83 H;7.01

 $MS: 212 (M^{+})$

(2) 2-(5-オクチル-2-チエニル) エチル 2-テトラヒドロピラニルエ ーテル

上記化合物(8.5g)の無水テトラヒドロフラン溶液(100m1)を-78℃に冷却し、n-ブチルリチウムのヘキサン溶液(1.63mol/ℓ,30m1)を滴下した。氷冷下にて、30分間攪拌した後、室温で30分間攪拌した。1-ブロモオクタン(10g)の無水テトラヒドロフラン溶液(15m1)を滴下し、室温にて7時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=20:1)にて精製すると、標記化合物(6.6g)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.85 (3H. t, 7Hz), 1.25 (10H. m), 1.53 (4H. m), 1.62 (2H. m), 1.72 (1H. m), 1.83 (1H. m), 2.71 (2H. t, J=7Hz), 3.02 (2H. t, J=7Hz), 3.46 (1H. m), 3.60 (1H. dt, J=10, 7Hz), 3.80 (1H. m), 3.92 (1H. dt, J=10, 7Hz), 4.61 (1H. t, J=3.5Hz), 6.54 (1H. d, J=3.4Hz), 6.61 (1H.

d. J=3.4Hz

IR (neat): 2927, 2854, 1135, 1120, 1033 cm^{-1} .

元素分析値 C19H32O2S:計算値:C;70.32 H; 9.94

分析値: C; 70. 12 H; 10. 03

 $MS: 324 (M^{+})$

(3) 2-(5-オクチル-2-チエニル) エタノール

上記化合物(6.5g)のメタノール溶液(80m1)に、テトラヒドロフラン(20m1)とpートルエンスルホン酸(0.3g)を加え、室温にて1時間 攪拌した。溶媒を留去後、酢酸エチルを加え、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて精製すると、標記化合物(4g)を油状物として得た。

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.86 (3H, t, J=7Hz), 1.27 (10H, m), 1.62 (2H, quint, J=7Hz), 2.73 (2H, t, J=7Hz), 3.00 (2H, t, J=6Hz), 3.80 (2H, t, J=6Hz), 6.58 (1H, d, J=3.4Hz), 6.64 (1H, d, J=3.4Hz)

IR (neat): 3348, 2927, 2854, 1466, 1047, 797 cm⁻¹

元素分析值 C14H24OS・0.1H2O:計算值:C;69.43 H;10.07

分析值:C;69.34 H;10.17

 $MS: 240 (M^{+})$

(4) 2 - (5-x) - (5-x) - (5-x) - (4) - (5-x) - (5-x)

上記化合物(4g)のジクロロメタン溶液(50m1)に氷冷下トリエチルアミン(3m1)を加える。これに、メタンスルホニルクロリド(1.5m1)を滴下し、30分間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、0.1 N塩酸および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;クロロホルム:メタノール=20:1)にて精製すると、標記化合物(5g)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.86 (3H. t. J=7Hz). 1.27 (10H. m), 1.61 (2H. quint. J=7Hz). 2.72 (2H. t. J=7.5Hz). 2.91 (3H. s), 3.17 (2H. t. J=3.4Hz), 4.37 (2H. t. J=6.5Hz). 6.58 (1H. d. J=3.4Hz), 6.67 (1H. d. J=3.4Hz)

IR (neat): 2927, 2854, 1357, 1176, 959, 802 cm⁻¹

元素分析值 C15H26O3S2:計算值:C;56.57 H;8.23

分析值: C; 56, 19 H; 8, 10

 $MS: 318 (M^{+})$

(5) 2-(5-オクチル-2-チエニル) エチルヨーダイド

上記化合物(4.8g)の2-プタノン溶液(50m1)にヨウ化ナトリウム(4.5g)を加え、室温にて17時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒; ヘキサン:酢酸エチル=<math>20:1)にて精製すると、標記化合物(4.9g)を油状物として得た。

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.86 (3H. t. J=7Hz). 1.28 (10H. m). 1.62 (2H. quint. J=7Hz). 2.72 (2H. t. J=7.5Hz). 3.30 (4H. m). 6.57 (1H. d. J=3.4Hz). 6.63 (1H. d. J=3.4Hz)

IR (neat): 2926, 2853, 1466, 1168, 796cm⁻¹

元素分析值 C14H28SI:計算值: C; 48.00 H; 6.62

分析值: C; 48. 29 H; 6. 99

 $MS: 350 (M^+)$

(6) ジエチル 2-アセトアミド-2-(2-(5-オクチル-2-チエニル) エチル) マロネート

無水ジメチルホルムアミド(20ml)に60%油性水素化ナトリウム(0.33g)を懸濁し、これにアセトアミドマロン酸ジエチル(1.82g)を加え、室温にて1時間攪拌した。次に上記化合物(2.7g)の無水ジメチルホルムア

ミド溶液(10m1)を滴下し、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和塩化アンモニウム水溶液で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒: ヘキサン:酢酸エチル=2:1)にて精製すると、標記化合物(1.4g)を結晶として得た。

融点=57~58℃

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta$:

0.86 (3H, t, J=7Hz), 1.25 (16H, m), 1.57 (2H, quint, J=7Hz), 2.0 (3H,

s), 2.61 (2H, m), 2.70 (4H, m), 4.20 (4H, m), 6.52 (1H, d, J=3.4Hz),

6.53 (1H, d. J=3.4Hz). 6.75 (1H, s)

IR (neat): 3278, 2923, 2852, 1746, 1647, 1211, 1195 cm⁻¹

元素分析值 C28H37NO6S:計算值:C: 62.84 H: 8.48 N: 3.19

分析值:C; 62.80 H; 8.42 N; 2.94

 $MS: 439 (M^{+})$

(7) 2-アセトアミド-2-〔2-〔5-オクチル-2-チエニル〕エチル〕-1, 3-プロパンジオール

水素化アルミニウムリチウム(0.38g)の無水テトラヒドロフラン溶液(15m1)に氷冷下、上記化合物(1.3g)の無水テトラヒドロフラン溶液(15m1)を滴下した。氷冷下で1時間攪拌した後、室温で1時間攪拌した。氷冷下、飽和硫酸ナトリウム水溶液を滴下し、水素化アルミニウムリチウムを分解後、不溶物を濾別し、濾液を酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;クロロホルム:メタノール=15:1)にて精製し、標記化合物(0.5g)を結晶として得た。

融点=58~60℃

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.86 (3H, t, J=7Hz), 1.27 (10H, m), 1.60 (2H, m), 1.94 (3H, s), 2.02 (2H, m), 2.71 (2H, t, J=7Hz), 2.82 (2H, t, J=7Hz), 3.57 (2H, dd, J=6,

12Hz). 3.71 (2H. br.s. 0H×2). 3.80 (2H. dd. J=6. 12Hz). 5.88 (1H. s). 6.54 (1H. d. J=3.4Hz). 6.58 (1H. d. J=3.4Hz)

IR(KBr): 3277, 2924, 2852, 1626, 1560, 1236, 1064, 1036 cm⁻¹元素分析值 C₁sH₃sNO₃S:計算值:C; 64.19 H; 9.36 N; 3.94 分析值:C: 63.75 H: 9.17 N: 3.68

 $MS: 355 (M^{+})$

(8) 2-アミノー2-〔2-(5-オクチルー2-チエニル)エチル〕-1,3-プロパンジオール・塩酸塩

上記化合物(500mg)のメタノール溶液(5m1)に水酸化リチウム(380mg)の水溶液(5m1)を加え、5時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去すると粉末が得られる。このものをエタノール(3m1)に溶解し、26%塩酸のエタノール溶液(2m1)を加える。溶媒を留去し、析出する結晶をヘキサンー酢酸エチルから再結晶することによって、標記化合物(150mg)を得た。

融点=63~65℃

 $^{1}H-NMR$ (CD₃OD) δ :

0.79 (3H. t, J=7Hz), 1.18 (10H. m), 1.53 (2H. m), 1.96 (2H. m), 2.63 (2H. t. J=7.5Hz), 2.74 (2H. m), 3.61 (2H. d. J=12.2Hz), 3.67 (2H. d. J=12.2Hz), 6.47 (1H. d. J=3.4Hz), 6.54 (1H. d. J=3.4Hz)

IR (KBr): 3482, 3265, 1631, 1530, 1468, 1059, 811 cm⁻¹

元素分析値 C₁₇H₃₁NO₂S・HCl: 計算値:C; 58.35 H; 9.22 N; 4.00

分析值:C; 58.12 H; 9.25 N; 4.03

 $MS: 313 (M^{+})$

実施例 294:2-rミノー 2-(4-オクチルスルフィニルベンジル)-1, 3-プロパンジオール

2-アセトアミド-2-(4-オクチルチオベンジル)-1,3-プロパンジオール(1.04g)のピリジン溶液(30ml)に無水酢酸(0.67ml)を加え、室温で4時間攪拌した。反応液を濃縮後、5%塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=4:1)にて精製し、標記化合物(0.73g)を得た。

融点=71~74℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.85 (3H, t, J=6.9Hz), 1.10 \sim 1.85 (12H, m), 1.94 (3H, s), 2.06 (6H,

s), 2.28(2H, t. J=7.8Hz), 3.19 (2H, s), 4.26 (4H, dd, J=11.2, 17.6Hz),

5. 48 (1H, br.s), 7. 03 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 20 (2H, d, J=8. 3Hz)

IR (KBr): 3295, 2924, 1739 cm⁻¹

 $MS: 451 (M^+)$

元素分析值 : 計算值: C; 63.83 H; 8.26 N; 3.10

分析值:C: 64.00 H: 8.32 N: 3.12

(2) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(4-オクチルスルフィニ ルベンジル) プロパン

上記化合物(0.73g)のクロロホルム溶液(15ml)に、氷冷下、メタクロル過安息香酸(0.56g)を加え、40分間攪拌した。反応液に水酸化カルシウム(0.23g)を加え、室温で1時間攪拌した後、不溶物を濾去し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;ジクロロメタン:メタノール=30:1)にて精製し、標記化合物(0.66g)を得た。

融点=70~72℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.85 (3H, t. J=7.3Hz), 1.10 \sim 1.80 (12H, m), 1.95 (3H, s), 2.07 (6H,

s), 2.76 (2H, m), 3.33 (2H, s), $4.09 \sim 4.16$ (4H, m), 5.54 (1H, s).

7. 29 (2H. d. J=8.3Hz), 7. 54 (2H. d. J=8.3Hz)

IR (KBr): 3278, 3081, 2928, 1746, 1672, 1218 cm⁻¹

 $\cdot \cdot \cdot MS : 467 (M^{+})$

元素分析值 : 計算值: C; 61.65 H; 7.97 N; 3.00

分析值: C: 61.36 H; 7.90 N; 2.93

(3) $2-r \le J-2-(4-x)$ 2-y J-2 J-2

上記化合物(300mg)のメタノール溶液(3m1)に水酸化リチウム(242mg)の水溶液(3m1)を加え、50℃で5時間攪拌した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、酢酸エチルーヘキサンから再結晶することにより、標記化合物(81.5mg)を得た。

融点=80~82℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.85 (3H, t, J=6.8Hz), $1.20 \sim 1.80$ (16H, m), $2.70 \sim 2.90$ (4H, m),

3. 44 (4H, dd, J=10.3, 17.1Hz), 7. 38 (2H, d, J=7.8Hz), 7. 55 (2H, d, J=7.8Hz)

IR (KBr): 3339, 2915, 2758, 1033 cm^{-1}

 $MS: 342 (M^{+})$

元素分析值 : 計算值:C; 63.31 H; 9.15 N: 4.10

分析值:C; 62.62 H; 9.04 N; 3.91

実施例295:2-アミノ-2-(4-オクチルスルホニルベンジル)-1,3 -プロパンジオール

(1) 2-rセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(4-オクチルスルホニルベンジル) プロパン

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(4-オクチルスルフィニルベンジル)プロパン(330mg)のクロロホルム溶液(10m1)に、氷冷下、メタクロル過安息香酸(244mg)を加え、2.5時間攪拌し、さらに室温で1.5時間攪拌した。反応液に水酸化カルシウム(0.1g)を加え、室温で45分攪拌した後、不溶物を濾去し、濾液を減圧下濃縮した。残渣をヘキサン-酢

·酸エチルから再結晶することにより標記化合物 (162mg)を得た。

融点=98~100℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.84 (3H, t, J=7.3Hz), 1.10 \sim 1.80 (12H, m), 1.96 (3H, s), 2.07 (6H,

s), 3.06 (2H, m), 3.38 (2H, s), 4.25 (4H, dd, J=11.7, 25.8Hz), 5.54

(1H. s), 7.34 (2H, d, J=8.2Hz), 7.81 (2H, d, J=8.2Hz)

IR (KBr): 3317, 2921, 2853, 1749, 1654, 1313, 1141 cm⁻¹

 $MS: 483 (M^{+})$

元素分析值 : 計算值: C; 59.61 H; 7.71 N; 2.90

分析值:C; 59.50 H; 7.60 N; 2.85

上記化合物(140mg)のメタノール溶液(2.5m1)に水酸化リチウム(109mg)の水溶液(2.5m1)を加え、50℃で4時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで抽出し、水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、ヘキサン-酢酸エチルにて再結晶することにより標記化合物(45mg)を得た。

融点=108~109℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.84 (3H, t, J=7.3Hz), 1.10 \sim 1.86 (16H, m), 2.83 (2H, s), 3.06 (2H, m), 3.43 (2H, s), 3.44 (2H, s), 7.43 (2H, d, J=7.8Hz), 7.82 (2H, d,

IR (KBr): 3343, 2915, 1299, 1147 cm⁻¹

 $MS: 357 (M^{+})$

J=7.8Hz

元素分析值 : 計算値(0.1H₂0): C; 60.17 H; 8.75 N; 3.90

分析值:C; 59.89 H; 8.79 N; 3.91

実施例296:2-7:1-2-(2-(3-オクチルフェニル)エチル1:

3-プロパンジオールおよびその塩酸塩

(1) 1-(3-プロモフェニル)オクタノール

マグネシウム(9.8g)の無水テトラヒドロフラン(100m1)溶液に、少量のヨウ素を加え、ヨウ素の色が消えるまで50でで攪拌した。これに、ヘプチルプロマイドの無水テトラヒドロフラン(200m1)溶液を1時間で滴下した。さらに65でで1時間攪拌した後、m-プロモベンズアルデヒドの無水テトラヒドロフラン(200m1)溶液を氷冷下で滴下し、室温で30分攪拌した。氷冷下、飽和塩化アンモニア水(7.3m1)を加え、1時間攪拌した。不溶物を濾過し、濾液を濃縮後、酢酸エチルに溶解し、水で洗浄した。硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=10:1)にて精製すると、標記化合物(50.9g)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₈) δ :

0.85 (3H, t, J=6.8Hz). 1.20 \sim 1.90 (13H, m), 4.61 (1H, m), 7.1 \sim 7.3 (2H, m), 7.36 (1H, dt, J=1.5, 7.8Hz), 7.49 (1H, m)

IR (neat): 3346, 2922, 2853 cm⁻¹

 $MS: 285 (M^{+})$

元素分析值 : 計算值:C; 58.96 H; 7.42 N; 0.00

分析值:C: 58.92 H: 7.36 N: 0.00

(2) トランス-1-(3-ブロモフェニル)-1-オクテン

上記化合物(10g)のベンゼン(500m1)溶液に、五酸化リン(24.9g)を加え、1.5時間、加熱還流した。不溶物を濾過し、濾液を水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=20:1)にて精製すると、標記化合物(9g)を油状物質として得た。

 $^{-1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.88 (3H, t, J=6.9Hz). 1.20 \sim 1.50 (8H, m), 2.19 (2H, dt, J=6.3. 6.5Hz). 6.21 (1H, td, J=6.3.16.1Hz), 6.28 (1H, d, J=16.1Hz), 7.13 (1H, t, J=7.9Hz), 7.21 (1H, m), 7.28 (1H, m), 7.47 (1H, m)

IR (neat): 3439, 3063 cm⁻¹

 $MS: 267 (M^{+})$

(3) トランス-1-(3-ホルミルフェニル)-1-オクテン

マグネシウム(1.38g)の無水テトラヒドロフラン(30m1)溶液に、少量のヨウ素を加え、ヨウ素の色が消えるまで50℃で攪拌した。これに上記化合物(13.8g)の無水テトラヒドロフラン(40m1)溶液を30分間で滴下した。さらに、55℃、1時間攪拌した後、室温でジメチルホルムアミド(4m1)の無水テトラヒドロフラン(30m1)溶液を1時間で滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、飽和塩化アンモニウム水を注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=30:1)にて精製すると、標記化合物(7.12g)を油状物質として得た。

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.86 (3H, t, J=6.8Hz), 1.20 ~1.60 (8H, m), 2.22 (2H, dt, J=6.8, 6.9 Hz), 6.32 (1H, td, J=6.8, 15.7Hz), 6.41 (1H, d, J=15.7Hz), 7.43 (1H, t, J=7.8Hz), 7.57 (1H, m), 7.68 (1H, m), 7.83 (1H, s), 9.99 (1H, s) IR (neat): 2956, 2927, 2855, 1699 cm⁻¹

 $MS: 216 (M^{+})$

元素分析值: C; 83.29 H; 9.32 分析值: C; 83.50 H; 9.29

上記化合物(6.17g)のジオキサン(30m1)溶液に、メチルメチルスルフィニルメチルスルフィド(3m1)およびトリメチルベンジルアンモニウムヒドロキシドのメタノール溶液(2.6m1)を加え、80℃で2時間攪拌した。反応液を濃縮後、酢酸エチルに溶解し、水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=4:1)にて精製すると、標記化合物(6.48g)を油状物質

として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.87 (3H, t, J=6.8Hz), 1.20 ~1.55 (8H, m), 2.12 (2H, dt, J=6.8, 6.9 Hz), 2.30 (3H, s), 2.75 (3H, s), 6.25 (1H, td, J=6.8, 16.1Hz), 6.37 (3H, t, J=16.1Hz), 7.30 ~7.40 (2H, m), 7.60 (1H, s), 7.72 (1H, m), 7.81 (1H, s)

IR (neat): 2955, 2925, 1068 cm⁻¹

 $MS: 322 (M^{+})$

(5) エチル3-(トランス-1-オクテニル)フェニルアセテート

上記化合物 (6.48g) のエタノール (40m1) 溶液に 26%塩化水素のエタノール (48m1) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル=20:1) にて精製すると、標記化合物 (5.11g) を油状物質として得た。

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.87 (3H, t, J=6.8Hz). 1.18 \sim 1.50 (11H, m), 2.19 (2H, dt, J=6.8,

6. 9Hz), 3. 57 (2H, s), 4. 13 (2H, q, J=7. 3Hz), 6. 22 (1H, td, J=6. 8,

16. 1Hz), 6. 33 (1H, d, J=16. 1Hz), 7. 10 \sim 7. 25 (4H, m)

IR (neat): 2957, 2927, 2855, 1737 cm^{-1}

 $MS: 274 (M^+)$

(6) 2-(3-(トランス-1-オクテニル)フェニル)エタノール

水素化アルミニウムリチウム(1.22g)を無水テトラヒドロフラン(150m1)に懸濁し、この中に氷冷下上記化合物(5.89g)を加え、1時間攪拌した。氷冷下、エタノール、水を加え、不溶物を濾別し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒:ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて精製することにより、標記化合物(4.22g)を油状物として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.87 (3H. t. J=6.8Hz), 1.10 \sim 1.50 (8H. m), 2.19 (2H. dt, J=6.8, 6.9

Hz), 2.83 (2H. t. J=6.3Hz), 3.85 (2H. dt. J=6.2, 6.3Hz), 6.20 (1H. td. J=6.8, 16.1Hz), 6.34 (1H. d. J=16.1Hz), 7.03 (1H. m), 7.18~7.27 (3H. m)

IR (neat): 3348, 2956, 2926, 2854 cm^{-1}

 $MS: 232 (M^{+})$

(7) 2- (3-(トランス-1-オクテニル) フェニル) エチルメタンスルホネ ート

上記化合物(4.19g)のジクロロメタン溶液(60m1)に、トリエチルアミン(2.8m1)を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロリド(14m1)を滴下し、室温にて1.5時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて精製すると、標記化合物(5.55g)を油状物質として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₈) δ :

0.87 (3H, t, J=6.8Hz), 1.20 ~1.50 (8H, m), 2.19 (2H. dt, J=6.8, 6.9 Hz), 2.83 (3H. s), 3.02 (2H. t, J=6.8Hz), 4.40 (2H. t, J=6.8Hz), 6.22 (1H, td, J=6.8, 15.6Hz), 6.33 (1H. d, J=15.6Hz), 7.03 (1H. m), 7.18~7.24 (3H. m)

IR (neat): 2956, 2927, 2855 cm⁻¹

 $MS: 310 (M^{+})$

(8) 2-(3-(トランス-1-オクテニル) フェニル〕エチルヨーダイド上記化合物(5.51g)の2-プタノン(60m1)溶液にヨウ化ナトリウム(3.99g)を加え、45°C、3時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水中に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=100:1)にて精製すると、標記化合物(4.75g)を油状物質として得た。

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.87 (3H, t, J=6.8Hz), 1.20 \sim 1.50 (8H, m), 2.19 (2H, dt, J=6.8, 6.9 Hz), 3.14 (2H, t, J=7.4Hz), 3.34 (2H, t, J=7.4Hz), 6.21 (1H, td, J=6.8, 18.1Hz), 6.34 (1H, d, J=18.1Hz), 7.00 (1H, m), 7.14 \sim 7.24 (3H, m)

IR (neat): 2956, 2925, 2853 cm⁻¹

 $MS: 342 (M^{+})$

(9) ジエチル2-アセトアミド-2-〔2-〔3-(トランス-1-オクテニル) フェニル) エチル〕マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル(7.62g)のエタノール(30m1)溶液にナトリウムエトキシド(7.62g)を加え、60℃で45分間攪拌した。次に、上記化合物(4g)のエタノール(20m1)溶液を滴下し、5時間加熱還流した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=3:1)にて精製すると、標記化合物(2.46g)を油状物質として得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0. 87 (3H, t, J=6.9Hz), 1. 22 (6H, t, J=6.8Hz), 1. 22 \sim 1. 50 (8H, m),

1.97 (3H. s). 2.17 (2H. dt. J=6.8, 6.9Hz). 2.43 (2H. m). 2.67 (2H.

m). $4.11\sim4.23$ (4H, m). 6.18 (1H, td, J=6.8, 16.1Hz), 6.31 (1H, d,

J=16.1Hz), 6.74 (1H. s), 6.94 (1H. d, J=6.8Hz), 7.09 \sim 7.18 (3H. m)

IR (neat): 3413, 2957, 2927, 1741, 1683 cm⁻¹

 $MS: 431 (M^{+})$

元素分析值 : 計算値(1/10 H₂0): C; 69.29 H; 8.65 N; 3.23

分析值:C: 69.04 H: 8.75 N:3.26

(0) 2-ret-re

水素化アルミニウムリチウム (0.74g) の無水テトラヒドロフラン (40

m1)溶液に、窒素気流下、上記化合物(2.8g)の無水テトラヒドロフラン(20m1)を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液にエタノールおよび水を加え、不溶物を濾別後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、溶媒を留去すると、黄色油状物質(2.34g)を得た。これをピリジン(60m1)に溶解し、氷冷下、無水酢酸(1.6m1)を加え、室温で2.5時間攪拌した。反応液を濃縮後、残渣を酢酸エチルに溶解し、飽和塩化アンモニウム水および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=4:1)にて精製することにより、標記化合物(1.8g)を白色結晶として得た。

融点=84~86℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.87 (3H, t, J=6.8Hz), 1.10 \sim 1.50 (8H, m), 1.94 (3H. s), 2.07 (6H,

s). $2.15\sim2.21$ (4H. m), 2.57 (2H, m), 4.33 (4H. s), 5.62 (1H. s),

6. 19 (1H, dt, J=6.8, 16.1Hz), 6. 33 (1H, d, J=16.1Hz), 6. 99 (1H, d,

J=6.8Hz), 7.13 \sim 7.21 (3H. m)

IR (KBr): 3311, 2961, 2926, 1738, 1652 cm⁻¹

 $MS: 431 (M^{+})$

元素分析值 : 計算值: C; 69.58 H; 8.64 N; 3.25

分析值:C; 69.85 H; 8.74 N; 3.35

(11) 2-r+r+r+r+1, 3-ir+r+1-2-(2-(3-ir+n)r+1)-ir+n) 2-r+1, 3-ir+n+1-2-(2-(3-ir+n)r+1)

上記化合物(1.41g)のメタノール(10m1)溶液に10%パラジウム 炭素(150mg)を懸濁したメタノール(10m1)溶液を加え、水素加圧(10気圧)下2時間攪拌した。反応容器を窒素置換した後、不溶物を濾別し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=2:1)にて精製することにより、標記化合物(1.05g)を白色結晶として得た。

融点=86~87℃

· $^{1}H-NMR$ (CDC1₈) δ :

0.86 (3H, t, J=6.9Hz), 1.10 \sim 1.60 (12H, m), 1.93 (3H, s), 2.07 (6H, s), 2.18 (2H, m), 2.52 (2H, t, J=6.8Hz), 2.56 (2H, t, J=6.8Hz), 4.33 (4H, s), 5.61 (1H, s), 6.95 \sim 7.05 (3H, m), 7.17 (1H, t, J=7.8Hz)

IR (KBr): 3313, 2960, 2925, 2854, 1738, 1651 cm⁻¹

(12) 2-アミノ-2- (2-(3-オクチルフェニル) エチル) -1, 3-プロ パンジオール

上記化合物(1.04g)のメタノール(10m1)溶液に水酸化リチウム(1g)の水溶液(10m1)を加え、5時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルに抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、シリカゲルカラムクロマト(展開溶媒;クロロホルム:メタノール=5:1)にて精製することにより、標記化合物(0.46g)を白色結晶として得た。

融点=89~92℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.85 (3H, t, J=6.4Hz), 1.20 ~1.35 (12H, m), 1.55 (2H, m), 1.83 (2H, m), 2.51 (2H, t, J=7.2Hz), 2.60 (2H, m), 2.98 (2H, br.s), 3.68 (2H, t, J=11.2Hz), 3.71 (2H, t, J=11.2Hz), 6.97 (3H, m), 7.12 (1H, t, J=7.3Hz)

IR (KBr): 3396, 3257, 2925, 2854 cm⁻¹

(13) 2-アミノー2-〔3-(3-オクチルフェニル)エチル〕-1,3-プロパンジオール・塩酸塩

上記化合物 (0.45g) をエタノール (20m1) に溶解し、26% 塩酸のエタノール溶液 (1m1) を加えた。溶媒を留去し、析出する結晶を再結晶(酢酸エチル:メタノール=30:1)することにより、標記化合物 (0.33g) を得た。

融点=99~101℃

 $^{1}H-NMR$ (DMSO) δ :

0.84 (3H. t. J=6.8Hz), 1.20 ~1.35 (12H. m), 1.53 (2H. m), 1.74 (2H. m), 2.40~2.60 (2H. m), 3.45 (4H. s), 5.33 (2H. br.s), 6.98 ~7.00 (3H. m), 7.18 (1H. t. J=7.3Hz), 7.70 (3H. br.s)

IR (KBr): 3178, 2924, 2853 cm⁻¹

実施例297:2-アミノ-2-(4-デシルフェニル)-1, 3-プロパンジ オール

(1) 4-プロモメチルデシルベンゼン

4 - デシルフェニルメタノール(3.91g)をトルエン(40m1)に溶解し、48%臭化水素酸(40m1)を加え、90℃で6時間加熱攪拌した。冷後有機相を分離し、飽和食塩水、重炭酸ナトリウム溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去し、油状の標記化合物(4.9g)を得た。

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0. 86 (3H, t, J=6.6Hz). 1. $2\sim1.3$ (14H, m). 1. $5\sim1.6$ (2H, m). 2. 57 (2H, t, J=7.6Hz). 4. 47 (2H, s). 7. 13 (2H, d, J=8.1Hz), 7. 28 (2H, d, J=8.0Hz)

(2) 4-デシルフェニルニトロメタン

亜硝酸銀(4.15g)、乾燥エーテル(20ml)をフラスコに入れ、氷冷した。攪拌下、4-プロモメチルデシルベンゼン(5.5g)のエーテル(10ml)溶液を滴下した。滴下終了後、氷冷下に4時間攪拌し、不溶物を濾別した。濾液の溶媒を留去し、ペンタンから結晶化すると、淡黄色結晶として標記化合物(1.44g)を得た。

融点=50℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.88 (3H. t. J=6Hz). 1.2~1.3 (14H. m). 1.5 ~1.6 (2H. m). 2.62 (2H. t. J=8Hz). 5.41 (2H. s). 7.24 (2H. d. J=8Hz). 7.28 (2H. d. J=8Hz)

(3) 2-(4-デシルフェニル)-2-ニトロ-1, 3-プロパンジオール
 4-デシルフェニルニトロメタン(555mg)をエタノール(5m1)に溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液(0.02m1)と37%ホルマリン(0

4 5 m 1) を加え、50℃で6時間加熱した。溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、ヘキサンから結晶化し、無色鱗片状の標記化合物(1.75g)を得た。

融点=80~81℃

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.88 (3H. t. J=6Hz), 1.2 \sim 1.3 (14H. m), 1.5 \sim 1.6 (2H. m), 2.59 (2H. t. J=8Hz), 2.77 (2H. m), 4.35 (2H. m), 4.60 (2H. m), 7.17 (2H. d. J=10Hz), 7.21 (2H. d. J=10Hz)

(4) 2-アミノ-2-(4-デシルフェニル)-1, 3-プロパンジオール 2-(4-デシルフェニル)-2-ニトロ-1, 3-プロパンジオール(170mg)をエタノール(30m1)に溶解し、5%パラジウム炭素(40mg)の存在下、水素圧20気圧にて接触還元反応を行った。8時間攪拌後、不溶物を 濾別し、濾液を濃縮した。残渣を分取薄層クロマトグラフ(シリカゲル)で精製し、標記化合物(8,9mg)を得た。

融点=136~137℃

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃-CD₃OD) δ :

0.88 (3H, t, J=8Hz), 1.1~1.4 (14H, m), 1.4~1.8 (2H, m), 2.3~2.7 (6H, m), 3.5~4.2 (4H, m), 7.2 (2H, d, J=10Hz), 7.33 (2H, d, J=10Hz) 塩酸塩の融点=113~114℃ (イソプロピルアルコールから再結晶) 実施例298:2-アセチルアミノー2-(4-デシルフェニル)-1, 3-プ

ロパンジオール

2-アミノー2-(4-デシルフェニル)-1, 3-プロパンジオール(313mg)をエタノール(20m1)およびクロロホルム(5m1)混合溶媒に溶解し、トリエチルアミン(0.4m1)を加え、ドライアイス-メタノールでー60℃に冷却した。これにアセチルクロリド(0.12m1)のジクロロメタン(5m1)溶液を冷却下、滴下した後室温にもどした。溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルに溶解し、食塩水、希塩酸水、重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去し、残渣を分取薄層クロマトグラフィー(

・シリカゲル)で精製し、ヘキサンから再結晶し、無色結晶の標記化合物 (130 mg)を得た。

融点=112~113℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.88 (3H, t, J=6.9Hz). 1.2 \sim 1.4 (14H, m), 1.5 \sim 1.7 (2H, m), 2.17

(3H, s), 2.58 (2H, t, J=7.9Hz), 3.66 (2H, dd, J=7.7Hz, 6Hz), 3.88

(2H, dd, J=12Hz, 7.6Hz), 4.05 (2H, dd, J=11.9Hz, 6Hz), 6.37 (1H, bs).

7. 20 (2H, d, J=8. 6Hz), 7. 25 (2H, d, J=8. 6Hz)

実施例299:5-アセトアミド-5-(4-デシルフェニル)-2, 2-ジメ チル-1, 3-ジオキサン

2-アセチルアミノー2-(4-デシルフェニル)-1,3-プロパンジオール(224mg)、2,2-ジメトキシプロパン(0.3m1)をベンゼン(5m1)に溶解し、触媒量のトルエンスルホン酸存在下、加熱還流した。冷後、重炭酸ナトリウム水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去し、残渣を分取薄層クロマトグラフィー(シリカゲル)で精製し、アモルファス晶の標記化合物(99mg)を得た。

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ :

0.88 (3H, t, J=6.6Hz), 1.2~1.4 (14H, m), 1.48 (3H, s), 1.51 (3H, s),

 $1.5 \sim 1.7$ (2H, m), 2.06 (3H, s), 2.56 (2H, t, J=7.8Hz), 4.14 (4H, s).

6. 23 (1H, bs), 7. 15 (2H, d, J=8. 3Hz), 7. 22 (2H, d, J=8. 3Hz)

実施例300:2-アミノ-2-(8-フェニルオクチル)-1, 3-プロパン ジオール

実施例301:2-アミノ-2-(9-フェニルノニル)-1,3-プロパンジ オール

実施例302:2-アミノ-2-(11-フェニルウンデシル)-1,3-プロ パンジオール

実施例303:2-アミノ-2-(12-フェニルドデシル)-1,3-プロパンジオール

実施例304:2-アミノ-2-(14-フェニルテトラデシル)-1,3-プ ロパンジオール

- 実施例305:2-アミノ-2-(15-フェニルペンタデシル)-1,3-プ ロパンジオール
- 実施例306:2-アミノ-2-(16-フェニルヘキサデシル)-1,3-プ ロパンジオール
- 実施例307:2-アミノ-2-〔2-(4-トリデシルフェニル)エチル)-1,3-プロパンジオール
- 実施例308:2-アミノ-2-〔2-(4-テトラデシルフェニル)エチル〕 -1,3-プロパンジオール
- 実施例309:2-アミノ-2-〔2-(4-ヘキシルオキシフェニル)エチル〕 -1、3-プロパンジオール
- 実施例 $3 1 0 : 2 7 \le J 2 (2 (4 デシルオキシフェニル) エチル)$ - 1, 3 - プロパンジオール
- 実施例311:2-アミノー2-(2-(4-ドデシルオキシフェニル)エチル) -1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 1 2 : 2 7 = 2 (2 (4 h) デシルオキシフェニル) エチル) 1, 3 プロパンジオール
- 実施例 3 1 3 : 2 アミノー 2 〔2 〔4 〔8 フルオロオクチル〕フェニル〕エチル〕-1, 3 プロパンジオール
- 実施例 3 1 4 : 2 アミノー 2 〔2 〔4 〔12 フルオロドデシル〕フェニル〕エチル〕-1, 3 プロパンジオール
- 実施例 $3 \ 1 \ 5 : 2 7 \le J 2 (2 (4 (7 7)))$ フェニル (2 (4 (7 7))) エチル (3 7) ロパンジオール
- 実施例 $3 1 7 : 2 \mathbb{P} \cdot \mathbb{P$

実施例318:2-アミノー2-(2-(4-(2-))ェニルエチルオキシ)フェニル)エチル)-1, 3-プロパンジオール

- 実施例 $3 \ 2 \ 1 : 2 r \ge J 2 (2 (4 (5 J ェニルペンチルオキシ)$ フェニル) エチル) -1, 3 プロパンジオール
- 実施例 $3 \ 2 \ 2 \ : \ 2 T \ 2 (2 (4 (7 フェニルヘプチルオキシ)$ フェニル) エチル) -1, 3 プロパンジオール
- 実施例323:2-アミノ-2-〔2-(4-(8-フェニルオクチルオキシ) フェニル)エチル)-1,3-プロパンジオール
- 実施例324:2-アミノ-2-〔4-(6-(4-フルオロフェニル) ヘキシ ルオキシ) フェニル) エチル〕-1, 3-プロパンジオール
- 実施例325:2-アミノ-2-〔2-(4-(4-フェノキシブチルオキシ) フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール

- 実施例329:2-アミノ-2-〔2-(4-(4-フェノキシブチル)フェニル)エチル)-1,3-プロパンジオール
- 実施例331:2-アミノ-2-〔2-(4-(6-フェノキシヘキシル)フェ ニル)エチル)-1,3-プロパンジオール

実施例 $3 \ 3 \ 2 : 2 - \mathbb{P} \ge J - 2 - (2 - (4 - (7 - \mathcal{D}_{x}J + \mathcal{D}_{y} \mathcal{D}_{y} \mathcal{D}_{y}))$ フェニル) エチル) -1, $3 - \mathcal{D}_{y} \mathcal{$

- 実施例333:2-アミノ-2-[2-(4-オクチルシクロヘキシル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例334:2-アミノ-2-〔2-(4-ノニルシクロヘキシル)エチル〕 -1,3-プロパンジオール
- 実施例 $3\ 3\ 5\ :\ 2-r$ > 2-(2-(4-)) デジルシクロヘキシル)エチル) - 1, 3-プロパンジオール
- 実施例336:2-アミノー2-〔2-〔1-オクチルピペリジンー4-イル) エチル〕-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 $3\ 3\ 7\ :\ 2\ -\ 7\ 2\ -\ (2\ -\ (1\ -\ F\ F)$ ルピペリジン $-\ 4\ -\ 4\ -\ 4\)$ エチル $) -\ 1$ 、 $3\ -\ 7\$ ロパンジオール
- 実施例338:2-アミノ-2-(2-(5-))エチル-1, 3-プロパンジオール
- 実施例339:2-アミノ-2-〔2-(5-デシル-2-チエニル)エチル〕 -1,3-プロパンジオール
- 実施例340:2-アミノ-2-〔2-(5-ドデシル-2-チエニル)エチル〕 -1,3-プロパンジオール
- 実施例341:2-アミノ-2-〔13-(2-チエニル)トリデシル)-1, 3-プロパンジオール
- 実施例342:2-アミノ-2-〔2-(5-オクチル-2-ピリジル)エチル〕 -1,3-プロパンジオール
- 実施例 3 4 3 : 2 アミノ 2 〔2 〔5 デシル 2 ピリジル〕エチル〕 - 1, 3 - プロパンジオール
- 実施例344:2-アミノー2-〔13-(2-ピリジル)トリデシル)-1, 3-プロパンジオール
- 実施例345:2-アミノー2-(2-オクチルー5-ピリジル) エチル) -1, 3-プロパンジオール

実施例346:2-アミノ-2-〔2-〔2-デシル-5-ピリジル)エチル〕 -1、3-プロパンジオール

- 実施例347:2-アミノ-2-〔13-(3-ピリジル)トリデシル〕-1, 3-プロパンジオール
- 実施例348:2-アミノ-2-(4-デシルフェニル)-1,3-プロパンジ オール
- 実施例 3 4 9 : 2 アミノ 2 (4 ドデシルフェニル) 1, 3 プロパン ジオール
- 実施例350:2-アミノー2-(4-テトラデシルフェニル)-1,3-プロパンジオール
- 実施例 3 5 1 : 2 アミノ 2 (4 ヘキサデシルフェニル) 1, 3 プロ パンジオール
- 実施例352:2-アミノ-2-〔1-ヒドロキシ-2-(4-オクチルフェニル)エチル〕-1,3-プロパンジオール
- 実施例 3 5 3 : 2 アミノ 2 〔2 〔4 ドデシルフェニル〕 1 ヒドロ キシエチル〕 - 1、3 - プロパンジオール
- 実施例 $3 \ 5 \ 4 : 2 r \ge J 2 (2 (4 ^プチルオキシフェニル) 1$ ヒドロキシエチル) 1 、 $3 ^プロパンジオール$
- 実施例 355:2-アミノー2-〔1-ヒドロキシー2-〔4-ウンデシルオキシフェニル〕エチル〕-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 357:2-rミノー 2-(2-(4-(12-7) + 2-7) + 2-7) フェニル) -1-1+7 ニル) -1+7 コート -1+7 コープロパンジオール
- 実施例 358:2-アミノー2-(2-(4-(7-フルオロヘプチルオキシ) フェニル) -1-ヒドロキシエチル) -1, 3-プロパンジオール
- 実施例359:2-アミノー2-〔1-ヒドロキシー2-〔4-〔11-フルオ

ロウンデシルオキシ)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール

実施例360:2-アミノ-2-〔2-(4-オクチルフェニル) エテニル) -1.3-プロパンジオール

実施例 3 6 1 : 2 - アミノ - 2 - (2 - (4 - デシルフェニル) エテニル) - 1, 3 - プロパンジオール

実施例 3 6 2 : 2 - アミノ - 2 - 〔2 - 〔4 - ドデシルフェニル〕エテニル〕 - 1, 3 - プロパンジオール

実施例363:2-アミノ-2-〔2- (4-テトラデシルフェニル) エテニル〕 -1,3-プロパンジオール

実施例364:2-アミノ-2-(4-オクチルフェノキシメチル)-1,3-プロパンジオール

実施例365:2-アミノ-2-(4-デシルフェノキシメチル)-1,3-プ ロパンジオール

実施例366:2-アミノ-2-(4-ドデシルフェノキシメチル)-1,3-プロパンジオール

実施例367:2-アミノー2-(4-テトラデシルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオール

実施例368:2-アミノー2-(1-ヒドロキシー2-フェニルエチル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩

融点=188~190℃

 ${}^{1}H-NMR (DMSO-d_{6})\delta (ppm) :$

2.57 (1H. dd, J=10.7, 14.2Hz), 2.88 (1H, d, J=14.2Hz), 3.63 (4H, m), 3.85 (1H, d, J=10.7Hz), 5.16 (1H, br.s), 5.28 (2H, br.s), 7.25 (5H, m), 7.77 (3H, br.s)

IR ν (KBr) $_{max}$: 3156. 2814. 1626. 1550. 1080. 1056. 743. 702 $_{cm}^{-1}$ 実施例 3 6 9 : 2 $_{-}$ アセトアミドー 1, 3 $_{-}$ ジアセトキシー 2 $_{-}$ (1 $_{-}$ アセトキシー 2 $_{-}$ フェニルエチル) プロパン、

透明オイル

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta (ppm) :$

1.89 (3H, s), 1.94 (3H, s), 2.08 (3H, s), 2.13 (3H, s), 2.83 (1H, dd, J=10.3, 14.2Hz), 3.05 (1H, dd, J=3.4, 14.2Hz), 4.46 (1H, d, J=11.7Hz), 4.48 (1H, d, J=11.7Hz), 4.55 (1H, d, J=11.7Hz), 4.71 (1H, d, J=11.7Hz), 5.66 (1H, dd, J=3.4, 10.3Hz), 5.86 (1H, s, -NH), 7.22 (5H, m)

実施例 370:(Z)-2-アミノ-2-スチリル-1, $3-プロパンジオール ^1H-NMR(CDC1₃)<math>\delta$ (ppm):

2. 62 (4H, br.s), 3. 47 (2H, d, J=11Hz), 3. 55 (2H, d, J=11Hz), 5. 55 (1H, d, J=12.7Hz), 6. 74 (1H, d, J=12.7Hz), 7. 27 (5H, m)

実施例 371: (E) -2-アミノ-2-スチリル-1, 3-プロパンジオール 1 H-NMR (CD $_{3}$ OD) δ (ppm):

3.51 (2H, d, J=11Hz), 3.63 (2H, d, J=11Hz), 6.10 (1H, d, J=16.4Hz),

6.55 (1H, d, J=16.4Hz), 7.23 (5H, m)

実施例372:2-アセタミド-2-〔2-(4-デシルフェニル)エチル〕-1、3-プロパンジオール ジアセテート

融点=101~104℃

 $^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta (ppm)$:

0.88 (3H, t, J=6Hz), 1.26 ~1.29 (16H, m), 1.95 (3H, s), 2.09 (6H, s), 2.17~2.21 (2H, m), 2.54~2.60 (4H, m), 4.35 (4H, s), 5.63 (1H, s), 7.09 (4H, s)

IR ν : 3310, 2919, 1735, 1654, 1231, 1058 cm⁻¹

実施例 $3 7 3 : 2 - 7 \in J - 2 - (2 - (4 - デシルフェニル) エチル) - 1,$ 3 - プロパンジオール・塩酸塩

融点=111~115℃

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta (ppm) :$

0.88 (3H, t, J=6Hz), 1.26 ~1.29 (16H, s), 1.92 ~1.96 (2H, m), 2.56

(2H, t. J=8Hz), 2.61~2.65 (2H, m), 3.71 (4H, q, J=12Hz), 7.11 (4H, s)

IR ν : 3373, 2923, 1603, 1518, 1070 cm⁻¹

実施例 374:2-アセタミドー2-(2-(4-(4-メチルペンチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール ジアセテート

融点=83~87℃

 ${}^{1}H-NMR (CDCl_{3})\delta (ppm) :$

0.91 (6H, d, J=6Hz), 1.57 (4H, s), 1.96 (3H, s), 2.09 (6H, s), 2.15 ~2.19 (2H, m), 2.51~2.58 (2H, m), 3.91 (2H, t, J=6Hz), 4.34 (4H, s), 6.81 (2H, d, J=4Hz), 7.08 (2H, d, J=4Hz)

I R ν : 3310, 2954, 1735, 1649 cm⁻¹

元素分析值:計算值: C 65.54, H 8.37, N 3.32

分析值: C 65.60, H 8.40, N 3.43

実施例375:2ーアミノー2ー〔2ー(4ー(4ーメチルペンチルオキシ)フェニル)エチル〕-1,3-プロパンジオール・1/10水和物

融点=125~128℃

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta (ppm) :$

0.83 (6H, d, J=6Hz). 1.25 (2H, t, J=6Hz). 1.54 \sim 1.58 (3H, m), 1.66 \sim 1.72 (2H, m), 2.47 \sim 2.51 (2H, m), 3.39 \sim 3.50 (4H, m), 3.81 \sim 3.85 (2H, m), 6.73 (2H, d, J=12Hz), 7.02 (2H, d, J=12Hz)

IR ν : 3324, 2951, 1513, 1247, 1026 cm⁻¹

実施例 3 7 6 : 2 - r セトアミド-2 - (2 - ピリジルメチル) - 1, 3 - プロパンジオール

 ${}^{1}H-NMR$ (400MHz, CDC1₃) δ (ppm) :

1.66 (2H. br.s. OH). 1.94 (3H. s. CH_3), 3.26 (2H. s. CH_2), 3.56 (4H. dd, J=72, 12Hz, $CH_2 \times 2$), 6.97 (1H. br.s. NH), 7.23 (1H. dd, J=8.0, 4.0Hz, ArH), 7.33 (1H. d. J=8.0Hz, ArH), 7.69 (1H. dt, J=8.0, 4.0Hz, ArH). 8.49 (1H. d, J=4.0Hz, ArH)

実施例377:2-アセトアミド-2-(2-ピリジルメチル)-1,3-ジアセトキシプロパン

 ${}^{1}H-NMR$ (400MHz, CDC1₃) δ (ppm):

1.96 (3H, s, CH_3), 2.05 (6H, s, $CH_3 \times 2$), 3.13 (2H, s, CH_2), 4.47

(4H, dd, J=40, 12Hz, $CH_2 \times 2$), 7.15 (1H, d, J=8.0Hz, ArH), 7.21 (1H,

dd, J=8.0, 4.0Hz, ArH), 7.48 (1H, s. NH), 7.65 (1H, dt, J=8.0, 4.0Hz,

ArH), 8.55 (1H, d, J=4.0Hz, ArH)

 $IR\nu$ (KBr) _{max} : 3320(NH), 1748 (CO), 1654, 1533, 1248 cm⁻¹

 $MS: 308 (M^+ + 1)$

融点=109~110℃

実施例378:2-アミノー2-(2-ピリジルメチル)-1,3-プロパンジオール・3/4水和物・2塩酸塩

 ${}^{1}H-NMR$ (400MHz, CD₃OD) δ (ppm) :

3.53 (2H, s, ArCH₂), 3.65 (4H, ddd, J=24, 12, 4.0Hz, $CH_2 \times 2$), 4.88

(6H, br.s, OH \times 2, N⁺H₃, N⁺), 8.02 (1H, t, J=8.0Hz, ArH), 8.09

(1H, d, J=8.0Hz, ArH). $8.57 \sim 8.61$ (1H, m, ArH). 8.81 (1H, d,

J=4.0Hz, ArH)

 $IR\nu$ (KBr) mex : 3385, 3070, 3059, 2945, 2897, 1621, 1066 cm⁻¹

 $MS: 183 (M^+)$

融点=165~170℃

実施例379:2-アセトアミド-2- (2-(5-プチルピリジル)メチル 1.3-プロパンジオール

 $^{1}H-NMR$ (400MHz, CDC1₃) δ (ppm):

0.94 (3H, t, d=8.0Hz, CH₃), 1.26 (2H, t, J=8.0Hz, CH₂), 1.36 (2H, m,

CH₂), 1.59 (2H, br.s, 0H×2), 1.93 (3H, s, CH₂), 2.58 \sim 2.62 (2H, m,

CH₂), 3.21 (2H, s, CH₂), 3.55 (4H, dd, J=72, 12Hz, $CH_2 \times 2$), 6.97 (1H,

br.s. NH), 7.22 (1H. d. J=8.0Hz, ArH), 8.45 ~8.50 (1H. m. ArH).

8.31 (1H, br.s. ArH)

IRν (neat) max : 3378(OH), 2958, 2933, 2862, 1738(CO), 1658 cm⁻¹ オイル

実施例380:2-アセトアミド-2- (2-(5-プチルピリジル)メチル] -1、3-ジアセトキシプロパン

 ${}^{1}H-NMR$ (400MHz, CDC1₃) δ (ppm):

0.94 (3H. t. J=8.0Hz, CH₃), 1.33 \sim 1.42 (2H. m. CH₂), 1.56 \sim 1.64 (2H. m. CH₂), 1.96 (3H. s. CH₃), 2.05 (6H. s. CH₃ \times 2), 2.60 (2H. t. J=8.0Hz, CH₂), 3.08 (2H. s. CH₂), 4.46 (4H. dd, J=40, 12Hz, CH₂ \times 2), 7.05 (1H. d. J=8.0Hz, ArH), 7.44 \sim 7.46 (1H. m. ArH), 7.56 (1H. s. NH), 8.35 \sim 8.37 (1H. m. ArH)

IRν (KBr) max : 3371, 3290, 2959, 2934, 1745(CO), 1681, 1240 cm⁻¹ オイル

実施例381:2-アミノ-2-〔2-(5-プチルピリジル)メチル〕1,3 -プロパンジオール

 $^{1}H-NMR$ (400MHz, CDC1₃) δ (ppm):

0.94 (3H, t, J=8.0Hz, CH₃), 1.36 (2H, dt, J=16, 8.0Hz, CH₂), 1.59 (2H, dt, J=16, 8.0Hz, CH₂), 2.60 (2H, t, J=8.0Hz, CH₂), 2.92 (2H, s. CH₂), 1.20 \sim 3.00 (4H, m, 0H \times 2, NH₂), 3.39 (4H, dd, J=36, 12Hz, CH₂ \times 2), 7.13 (1H, d, J=8.0Hz, ArH), 7.48 (1H, dd, J=8.0, 2.0Hz, ArH), 8.33 (1H, d, J=2.0Hz, ArH)

IRν (KBr) max : 3339, 3269, 2923, 2857, 1595, 1033 cm⁻¹ 融点=63~65℃

実施例382:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-〔2-(1-オ クチルピペリジン-4-イル)エチル〕プロパン

融点=93~95℃

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3})\delta (ppm) :$

0.85 (3H, t, J=6.4Hz), 1.19 \sim 1.36 (15H, m), 1.50 (2H, br.s), 1.64 (2H, d, J=11.8Hz), 1.85 \sim 1.97 (3H, m), 1.93 (3H, s), 2.05 (6H, s),

2.33 (2H. br.s), 2.97 (2H. br.s), 4.25 (4H, s), 5.61 (1H, s)

 $IR\nu$ (KBr) max : 3302, 1739, 1654, 1560 cm⁻¹

実施例383:2-アセトアミド-2-(2-プロペニル)-1, 3-プロパン ジオール

淡黄色液体

Rf値: 0. 55 (クロロホルム: メタノール=5:1)

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃ -CD₃ OD) δ (ppm) :

1.95 (3H, s). 2.33 (2H, d, J=7.3Hz). 3.49 (2H, d, J=11.7Hz), 3.64

(2H, d, J=11.7Hz), 5. 07 ~5. 10 (2H, m), 5. 66~5. 90 (1H, m)

 $IR\nu$ (neat): 3310, 1641 cm⁻¹

MS (EI) : 174 (M+1)

実施例384:2-アミノ-2-(2-プロペニル)-1, 3-プロパンジオール・8/5水和物・塩酸塩

褐色液体

 ${}^{1}H-NMR (CDC1_{3}) \delta (ppm) :$

2.33 (2H. d. J=10.7Hz), 3.56 (4H. dd. J=3.0Hz. J=19.0Hz), 3.39 (11H. br.s), 5.14 ~5.22 (2H. m), 5.62~5.23 (1H. m)

IR ν (neat): 3445, 1614, 1516 cm⁻¹

MS (E I) : 132 (M+1)

元素分析值:計算值: C 36.68. H 8.82. N 7.13

分析值: C 36.27. H 8.47. N 7.26

実施例385:2-アミノー2-フェニルメチルオキシメチルー1, 3-プロパンジオール・1/10水和物・塩酸塩

融点=113~114℃

実施例386:2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-フェニルメチルオキシメチルプロパン

IR ν (neat): 3307, 2934, 1743, 1662, 1549 cm⁻¹

実施例387:2-アミノ-2-〔2-(4-ノニルフェニル)エチル〕-1.

3-プロパンジオール・1/3水和物・塩酸塩

融点=95~97℃

元素分析值:計算值: C 66.00, H 10.15, N 3.85

分析值: C 66.19. H 10.24. N 3.86

融点=95~98℃

実施例 3 8 8 : 2 - アセトアミド-2 - (2 - (4 - ウンデシルフェニル) エチル) -1, 3 - プロパンジオール

融点=90~91℃

実施例389:2-アミノ-2-〔2-〔4-ウンデシルフェニル〕エチル〕-1,3-プロパンジオール

融点=105~107℃

 $^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ (ppm):

0.88 (3H, t, J=6.8Hz), 1.20 \sim 1.80 (24H, m), 2.56 (2H, t, J=7.8Hz),

2.61 (2H, m), 3.51 (2H, d, J=10.8Hz), 3.61 (2H, d, J=10.8Hz), 7.10 (4H, s)

実施例 3 9 0 : 2 - アセトアミドー 4 - (4 - ヘプチルフェニル) - 2 - ヒドロキシメチル <math>-1, 4 - プタンジオール

融点=117~118℃

実施例391:2-アセトアミド-4-(4-オクチルフェニル)-2-ヒドロ キシメチル-1,4-プタンジオール

融点=118~119℃

実施例392:2-アセトアミドー2-(2-(4-ヘプチルフェニル) エチル) 1, 3-プロパンジオール

融点=89~90℃

実施例393:2-アセトアミド-2-1,3-プロパンジイル-〔2-(4-ヘプチルフェニル)エチル〕イリデン ジアセテート

- 融点=108~109℃

実施例394:2-アミノ-2-〔2-(4-ヘプチルフェニル)エチル〕-1 、3-プロパンジオール・塩酸塩

融点=134~135℃

 ${}^{1}H-NMR (DMSO only)\delta (ppm)$:

0.83 (3H, t. J=6Hz), 1.17 \sim 2.33 (8H, m), 1.45 \sim 1.58 (2H, m), 1.69 \sim

1.79 (2H, m), 2.48~2.62 (4H, m), 3.34 (2H, br.s), 3.48 (4H, s),

7.08 (4H, s), 7.47 (3H, br.s)

 $IR\nu$ (KBr) _{max} : 3369, 2926, 1515, 1467, 1059 cm⁻¹

融点=125~126℃

融点=123~124℃

 ${}^{1}H-NMR (DMSO-CDC1_{3})\delta (ppm) :$

0.80 (3H, t, J=6Hz), 1.02 \sim 1.24 (22H, m), 1.45 \sim 1.53 (2H, m), 1.88

(2H, m, J=4Hz), 2.46 $(2H, t, J=6Hz), 2.56 \sim 2.62$ (2H, m), 3.56 (2H, m), 3.56

dd. J=12Hz, 31Hz), 3.57 (2H, dd, J=12Hz, 31Hz), 4.90 (2H, br.s),

7.01 (4H. dd. J=7Hz. 12Hz), 7.99 (3H. br.s)

 $IR\nu$ (KBr) max : 3374, 3268, 2922, 1516, 1469, 1069 cm⁻¹

実施例 3 9 7 : N - メチルアミノ - 2 - (2 - (4 - オクチルフェニル) エチル) - 1, 3 - プロパンジオール

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ (ppm) :

0.80 (3H, t, J=7Hz), 1.09 \sim 1.39 (10H, m), 1.45 \sim 1.56 (2H, m), 1.56

~1.76 (2H, m), 2.41 (3H, s), 2.44~2.61 (4H, m), 3.32 (3H, br.s),

 $3.47\sim3.81$ (4H. m), 7.01 (4H. s)

IR ν (neat): 3386, 2927, 1467, 1058, 909 cm⁻¹

実施例 $3 9 8 : 2 - 7 \le J - 4 - (4 - {} - {} {} - {} {} - {} {} - {} 2 - {} | - {} | + {} - {} |$ チルー 1 , 4 - 7 タンジオール塩酸塩

融点=105~108℃

 $^{1}H-NMR (DMSO) \delta (ppm) :$

0.86 (3H, t, J=7Hz), 1.17 ~1.36 (8H, m), 1.46~1.63 (2H, m), 1.76 (2H, dd, J=7Hz, 18Hz), 2.54 (2H, t, J=7Hz), 3.34 (3H, br.s), 3.58 (4H, dd, J=11Hz, 35Hz), 4.83~4.92 (1H, m), 6.99 (3H, br.s), 7.18 (4H, dd, J=7Hz, 37Hz)

 $IR\nu$ (KBr) max : 3388, 2928, 1610, 1511, 1063 cm⁻¹

実施例 399:2-r > 1-4-(4-オクチルフェニル) -2-ヒドロキシメチル-1, 4-プタンジオール・<math>1/4水和物

 ${}^{1}H-NMR$ (CDC1₃) δ (ppm) :

0.86 (3H, t, J=7Hz), 1.22 ~1.38 (10H, m), 1.54 ~1.68 (3H, m), 1.68 ~1.79 (1H, m), 2.59 (2H, t, J=7Hz), 3.40 (3H, br.s), 3.50 (4H, dd, J=8Hz, 38Hz), 3.63 (2H, br.s), 4.91 (1H, m), 7.20 (4H, dd, J=6Hz, 30Hz)

IR ν (neat): 3340, 3286, 2925, 1465, 1027cm⁻¹

以下に実験例を挙げて、本発明の作用・効果をさらに詳細に説明する。

免疫抑制活性測定法としては、マウス、ラットあるいはヒトのリンパ球を用いた種々の免疫反応を用いることができるが、例えば免疫抑制活性は、マウス、ラット、ヒトの同種リンパ球混合反応(同種MLR)を用いることにより感度よく測定できる。

同種MLRとは、同種でしかも主要組織適合性抗原が異なる2個体由来のリンパ球、例えば脾細胞、リンパ節細胞、末梢血リンパ球等を混合培養することによって誘導されるリンパ球の幼若化反応である。また、同種MLRは、リンパ球の供与者間の主要組織適合性抗原の違いを反映し誘導される現象であり、例えば一卵性双生児のリンパ球の混合培養によるリンパ球の幼若化現象は認められない。そこで同種MLRは、例えば臓器移植における供与者-受容者の選択に広く用い

られている方法である。

通常、同種MLRを行う場合には、一方のリンパ球をX線照射あるいはマイトマイシンC処理等を行うことによって、分裂増殖を阻止した状態で刺激細胞として用い、他方のリンパ球(反応細胞)の幼若化反応を測定する方法 (one way-MLR) を用いることができる。

さらに免疫抑制活性は、同種MLRの際に誘導される主要組織適合性抗原拘束 性を有する細胞障害性T細胞の誘導を抑制する活性としても測定することができ る。

また、免疫抑制活性は、同種MLRの他に、種々のマイトージェン(コンカナバリンA、フィトへムアグルチニン、ポークウィードマイトージェン等)の刺激により誘導されるリンパ球の幼若化反応を抑制する活性、またはT細胞、B細胞等のリンパ球の分裂増殖を増強もしくは分化を促進する活性を有するようなサイトカイン(インターロイキン1、2、3、4、5、6等)により誘導されるリンパ球の分裂増殖反応、または機能の発現を抑制する活性としても評価することができる。さらに、これらサイトカインのT細胞、マクロファージ等からの産生を抑制する活性としても評価することが可能である。

さらに、化合物をマウス等に腹腔内、経口、静脈内、皮内、皮下または筋肉内 投与をすることによって、例えば同種細胞等で予め免疫されたマウスの脾細胞中 に誘導される同種細胞特異的細胞障害性T細胞の誘導を抑制する活性、ならびに 同種細胞等で免疫したマウスの血清中に産生される同種細胞特異抗体の産生を抑 制する活性、または同種マウスのラット、イヌなどの臓器移植の際の拒絶反応、 あるいは移植片対宿主反応、あるいは遅延型アレルギー、アジュバント関節炎等 を抑制する活性としても評価することができる。

また、自己免疫疾患のモデル動物であるMRL/lprマウス、NZB/WF1マウス、BXSBマウス、NODマウス等に化合物を投与することによる、例えば抗DNA抗体の産生、リウマチ因子の産生、腎炎、リンパ球の増殖異常、尿タンパク等の抑制活性あるいは延命効果としても評価することができる。

実験例1 (マウス同種リンパ球混合反応に対する抑制作用)

・マウス同種リンパ球混合反応(以下、マウス同種MLRと称する)は、反応細胞としてBALB/cマウスの脾細胞を、刺激細胞としてC57BL/6マウスの脾細胞をマイトマイシンC処理したものを用い、両者を等比で混合培養することによって行う。

反応細胞の調製法としては、以下の方法で行う。 $5 \sim 6$ 週齢のBALB/cマウスより脾臓を摘出し、熱不活化牛胎児血清(以下、FCSと称する)を5% が加したRPMI1640培地(硫酸カナマイシン 60μ g/m1、ペニシリンGカリウム100単位/m1、N-2-ヒドロキシエチルピペラジン-N'-2-エタンスルホネート10mM、0.1%炭酸水素ナトリウム、L-グルタミン2mM含有)を用いて、脾細胞の単細胞浮遊液を得る。溶血処理後、 10^{-4} M2ーメルカプトエタノールおよび10%FCSを含むRPMI1640培地を用いて、 10^{7} 個/m1に調製し、反応細胞浮遊液として用いる。

刺激細胞は以下の方法で調製する。 $5\sim6$ 週齢のC57BL/6マウスより脾臓を摘出し、RPMI1640培地を用いて脾細胞の単細胞浮遊液を得る。溶血処理後、 40μ g/m1マイトマイシンCで37 $^{\circ}$ C、60分間の処理を行う。3回洗浄後、 10^{-4} M 2-メルカプトエタノールおよび10%FCSを含むRPMI1640培地を用いて、 10° 個/m1に調製し、刺激細胞浮遊液として用いる。

上述した方法により調製した反応細胞浮遊液 50μ 1 と刺激細胞浮遊液 50μ 1 および 10% F C S を含む R P M I 1640 培地を用いて調製した被検体 100μ 1 とを、96 穴平底マイクロテストプレートに加え、37%で 5% 炭酸 ガス 95% 空気の条件下で 4 日間培養を行う。

マウス同種MLRにおけるリンパ球の幼若化反応の測定法としては、 ³H-チミジンの取り込みを指標とする方法を用いる。即ち、培養終了後に ³H-チミジン18.5 KBq/ウエルを添加し、4時間培養後、セルハーベスターにて細胞を収集し、細胞内に取り込まれた放射活性を液体シンチレーションカウンターにて測定し、マウス同種MLRのリンパ球幼若化の指標とする。マウス同種MLRの抑制活性は、数1の式により抑制率を算出し評価する。

本発明の化合物のうち、好ましい化合物群はマウス同種リンパ球混合反応に対して、約1~約50nMのIC 50値(50%抑制する濃度)を示す。

本発明の化合物のうち、好ましい化合物群はマウス同種リンパ球混合反応に対して、約1~約50nMのICso値(50%抑制する濃度)を示す。

実験例2(インターロイキン2(IL-2)により誘導されるIL-2依存性マウスT細胞株CTLL-2の増殖に対する抑制作用)

IL-2依存性マウスT細胞株CTLL-2を10%FCSを含むRPMI1640培地にて2×10 5 個/mlに調製する。この細胞浮遊液 50μ 1と、リコンビナントヒトIL-2(rh-IL-2)40U/mlを 50μ 1、および10%FCSを含むRPMI1640培地を用いて調製した被検体 100μ 1とを96穴平底マイクロテストプレートに加え、37%、5%炭酸ガス95%空気の条件下で68時間培養を行う。培養終了後、各ウエルの上清 100μ 1を除去し、 $5mg/m10MTT(3-(4,5-ジメチルチアゾール-2-イル)-2,5-ジフェニルテトラゾリウムプロマイド)溶液を<math>20\mu$ 1ずつ各ウエルに添加し、4時間、37%でインキュベートする。その後、10%ドデシル硫酸ナトリウムを含む0.01N塩酸溶液 100μ 1を加え、一晩37%でインキュベートし、形成された紫色のホルマザンの結晶を溶解させ、マイクロプレート吸光光度計を用いて570m1における吸光度を測定し、1L-2依存性のCTLL-2細胞の増殖の指標とする。1L-2依存性増殖の抑制率(%)は数2の式により算出する。

本発明の化合物のうち、好ましい化合物群は、マウスT細胞株CTLL-2の

IL-2依存性増殖に対して、約1~約50nMのIC。値(50%抑制する濃度)を示す。

実験例3 (ラット同種皮膚移植における生着延長効果)

4週齢の雄性WKAHラットまたはLEWラットの全層皮膚移植片(1.5×1.5cm)を4週齢の雄性F344ラットの背部移植床に縫合により移植を行い、無菌のガーゼでおおい包帯する。包帯は移植後5日目に除去し、移植片が拒絶されるまで毎日観察を行う。皮膚移植片の拒絶は移植片の上皮の90%以上が壊死を起こし褐色になった時点で判定する。移植した日から拒絶された時点までの日数を移植片の生着日数とする。試験化合物は移植当日から1日1回、9日目まで10回腹腔内、静脈内あるいは経口投与を行う。

試験化合物未投与のときには、WKAHラットの皮膚をF344ラットに移植した場合の平均生着日数は 6.6 ± 0.5 日、またはLEWラットの皮膚をF344ラットに移植した場合の平均生着日数は 8.2 ± 0.4 であった。

本発明のなかで望ましい化合物は 0. 1~10 m g/k gの投与によりWKA Hラットの皮膚をF344ラットに移植した場合には平均生着日数は10日以上、 またLEWラットの皮膚をF344ラットに移植した場合には平均生着日数は2 0日以上で、試験化合物未投与群に対して統計学的に有意な生着延長効果を示す。 実験例4(ラットアジュバント関節炎に対する抑制作用)

アジュバントとして結核死菌(R35H5v-1株)0.5mgを1.0ml の流動パラフィンに懸濁し、10週齢の雄性LEWラットの尾根部に接種しアジュバント関節炎を発症させる。アジュバント接種後、毎日観察を行い関節炎の発

症日、発症率、体重変化を測定するとともに、21日目に後肢足の腫張および臓器重量を測定する。試験化合物はアジュバント接種当日から1日1回、21日目まで22回静脈内あるいは経口投与を行う。

試験化合物未投与のときには、アジュバント接種ラットにおいて関節炎は9.6±0.5日で7例中全例が発症し、後肢足の腫張および骨破壊が認められた。またアジュバント関節炎の発症に伴い、体重の減少、腎および副腎重量の増加、胸腺重量の減少が認められた。

本発明のなかで望ましい化合物は0.1~10mg/kgの投与によりアジュバント関節炎の発症日を統計学的に有意に遅延させ、発症率を減少させるとともに、後肢足の腫張および骨破壊を有意に抑制する。また、アジュバント関節炎の発症に伴う体重の減少、腎および副腎重量の増加、胸腺重量の減少の有意な改善作用が認められる。

上記した薬理実験を含む各種実験から明らかなように、本発明の化合物または それらの塩は優れた免疫抑制作用を有し、医薬として有用である。

処方例

(1)ソフトカプセル剤(1カプセル中)

≘ L	2 F 0 m ~
ポリソルベート80	2 0 m g
ポリエチレングリコール-300	3 0 0 m g
本発明の化合物	3 0 m g

計

350mg

製造方法

本発明の化合物にポリエチレングリコール-300およびポリソルベート80 を加え、ソフトカプセルに充塡して製する。

(2)注射剤(1アンプル 10m1中)

本発明の化合物 0.3% ポリエチレングリコール-300 20% エタノール 60%

注射用蒸留水で全量10m1とする。

製造方法

本発明の化合物にエタノールおよびポリエチレングリコール-300を加えて 溶解し、注射用蒸留水を加えて全容とする。

1アンプル10m1中本発明の化合物30m1を含有した注射剤を得る。

本発明を実施例を含む明細書により具体的に説明したが、特に実施例は本発明の精神と範囲に反しない限り、種々に変更、修飾することができる。

請求の範囲

1. 一般式

$$R^{2}R^{3}N \xrightarrow{C} CH_{2}OR^{5}$$

$$R^{2}R^{3}N \xrightarrow{R} CH_{2}OR^{5}$$

$$R$$

$$(1)$$

(式中、Rは置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖(当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R⁶)-(ここで、R⁶ は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいへテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体が置換していてもよい)または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいアリールを活動していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいアリールを示すが、R⁶ 、R⁶ がアルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示すか、R⁶、R⁶ がアルキル、アリールまたはアカルキルにより置換されていてもよいアルキレン鎖により結合していてもよい。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルで、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールはしくはその脂環体からルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体から

選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアシー、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。

ただし、Rが炭素数 $1\sim 5$ 個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、Rがフリルメチル、フェニルメチルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニルメチルのとき、 R^2 、 R^3 の一方はメチルまたはエチルではない。〕により表される 2- アミノー 1 、3- プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

2. 一般式

$$R^{2}R^{3}N \xrightarrow{C} CH_{2}OR^{5} \qquad (I-1)$$

$$CH_{2}R^{1}$$

〔式中、R¹ は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖 {当該鎖

中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R^6)-(ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいへテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端(ω 位)に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよい・フロアリールもしくはその脂環体が置換していてもよい)または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキル、アシルまたはアリール、置換基を有していてもよいアリールもしくはその脂環体を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示すか、 R^4 、 R^5 がアルキル、アリールまたはアラルキルにより置換されていてもよいアルキレン鎖により結合していてもよい。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルで、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニ

ルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。

ただし、 R^1 が炭素数 $1 \sim 4$ 個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、 R^1 がフリル、フェニルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニルのとき、 R^2 、 R^3 の一方はメチルまたはエチルではない。〕により表される請求の範囲 1 記載の 2- アミノー 1 、3- プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

3. 一般式

$$CH_2OR^4a$$
 $R^2aR^3aN \xrightarrow{\qquad \qquad } C \xrightarrow{\qquad } CH_2OR^5a$
 CH_2R^1a
 $(I-2)$

〔式中、 R^1 aは置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖 {当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N (R^6) - (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいフェニレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンから選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよい 、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいシクロアルキルを示し、 R^2 a、 R^3 a、 R^4 a、 R^5 aは同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。

ここで、置換基を有していてもよいフェニルおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルは、置換基として、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖 (当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R⁶)-(ここで、R⁶ は水素、アルキル、アラルキル、アシルま

たはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいフェニレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンから選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよい}、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいフェノキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルから選ばれる基を有していてもよい。

また、置換基を有していてもよい炭素鎖は、置換基として、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいシクロアルキルから選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいフェニレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいシクロアルキルは、その置換基として、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルでミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。

ただし、 R^1 aが炭素数 $1 \sim 4$ 個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、 R^1 aがフリル、フェニルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニルのとき、 R^2 aの一方はメチルまたはエチルではない。」により表される

請求の範囲1または2記載の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

4. 一般式

$$R^{2}bR^{3}bN \longrightarrow C \longrightarrow CH_{2}OR^{5}b \qquad (I-3)$$

$$CH_{2}R^{1}b$$

〔式中、 R^1b は置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいフェニルまたは置換基を有していてもよいシクロアルキルを示し、 R^2b 、 R^3b 、 R^4b 、 R^5b は同一または異なってそれぞれ水素、アルキルまたはアシルを示す。

ここで、置換基を有していてもよいアルキール、置換基を有していてもよいアルケール、置換基を有していてもよいアルキールは、置換基としてアルコキシ、アルケールオキシ、アルキールオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボール、アルコキシカルボールアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいフェニルおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルから選ばれる基を有していてもよい。また、前記置換基を有していてもよいフェニルおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルは、置換基として、アルキル、アルケニル、アルキール、アルキン、アルキルオキシ、アルキールオキシ、アカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシおよびカルボキシから選ばれる1~3個を有することができる。

ただし、 R^1b が炭素数 $1\sim 4$ 個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、 R^1b がフリル、フェニルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニ

ルのとき、 R^2b 、 R^3b の一方はメチルまたはエチルではない。〕により表される請求の範囲3記載の2-アミノー1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

5. 一般式

$$CH_2OR^4b$$
 $R^2bR^3bN \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OR^5b$
 Ra
 Ra

〔式中、Ra は鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R 6)-(ここで、R 6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)およびカルボニルから選ばれる結合または複素原子を有していてもよく、また置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい炭素数12から22個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを示し、R 2 b、R 3 b、R 4 b、R 5 bは同一または異なってそれぞれ水素、アルキルまたはアシルを示す。)により表される請求の範囲1、2、3または4記載の2-アミノ-1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

6. 一般式

$$R^2cR^3cN \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OH$$
 (I-5)

〔式中、Rb は鎖中に酸素原子を有していてもよく、また置換基として、ニトロ、 ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい炭素数13から 20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを示し、R2c、R3cは同一または異なっ

てそれぞれ水素、アルキルを示す。〕により表される請求の範囲5記載の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。 7. 一般式

〔式中、Rc は炭素数13から20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルまたは置換基としてハロゲンを有する炭素数13から20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを示す。〕により表される請求の範囲5または6記載の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

9. 一般式

〔式中、Rd はフェニルアルキル、置換フェニルアルキル、シクロアルキルアルキル、置換シクロアルキルアルキル、ヘテロアリールアルキル、 置換ヘテロアリ

ールアルキル、ヘテロサイクリックアルキルまたは置換ヘテロサイクリックアル キルを示す。

ここで、アルキル部は炭素鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N ($R^{\mathfrak{g}}$) - (ここで、 $R^{\mathfrak{g}}$ は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)およびカルボニルから選ばれる結合または複素原子を有していてもよく、また置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい。

また、置換フェニルアルキル、置換シクロアルキルアルキル、置換へテロアリールアルキルまたは置換へテロサイクリックアルキルは、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、ハロアラルキルオキシ、アラルキルオキシ、ハロアカルギン、アカキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。」により表される請求の範囲1、2、3または4記載の2-アミノ-1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

10. 一般式

$$H_2N \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OH$$
Re
(I-8)

〔式中、Re はアルキル部の炭素数が $6 \sim 20$ 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいフェニルアルキル;炭素数 $6 \sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルキル、炭素数 $6 \sim 20$ 個の直鎖もしくは分枝鎖状

のハロゲンで置換されていてもよいアルコキシ、炭素数 6~20個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、フェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシアルキル、フェノキシアルコキシもしくはフェノキシアルキルにより置換されたフェニルアルキル;アルキル部の炭素数が 6~20個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいシクロアルキルアルキル;アルキル部の炭素数が 6~20個であって、直鎖または分枝鎖状のアルキルにより置換されたシクロアルキルアルキル;アルキル部の炭素数が 6~20個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロアリールアルキル;アルキル部の炭素数が 6~20個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいヘテロサイクリックアルキルまたは炭素数 6~20個の直鎖もしくは分枝鎖状でもよいヘテロサイクリックアルキルまたは炭素数 6~20個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロサイクリックアルキルを示す。

ここで、アルキル部は炭素鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R^6)-(ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)およびカルボニルから選ばれる結合または複素原子を有していてもよく、また置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい。)により表される請求の範囲 9 記載の2-rミノ-1, 3-rロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

11. 一般式

$$H_2N \longrightarrow C \\ C \\ H_2OH$$
 (I-9)

〔式中、Rf はアルキル部の炭素数が6~20個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が1または2個介在していてもよいフェ

ニルアルキル:炭素数6~20個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換され ていてもよいアルキル、炭素数6~20個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで 置換されていてもよいアルコキシ、炭素数6~20個の直鎖もしくは分枝鎖状の アルケニルオキシ、フェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルア ルコキシアルキル、フェノキシアルコキシもしくはフェノキシアルキルにより置 換されたフェニルアルキル;アルキル部の炭素数が6~20個であって、直鎖ま たは分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が1または2個介在してい てもよいシクロアルキルアルキル : 炭素数 6~20個の直鎖もしくは分枝鎖状の アルキルにより置換されたシクロアルキルアルキル;アルキル部の炭素数が6~ 20個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が 1または2個介在していてもよいヘテロアリールアルキル:炭素数6~20個の 直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロアリールアルキル:ア ルキル部の炭素数が6~20個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当 該炭素鎖中に酸素原子が1または2個介在していてもよいヘテロサイクリックア ルキルまたは炭素数6~20個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換さ れたヘテロサイクリックアルキルを示す。

ここで、アルキル部は炭素鎖に置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい。〕により表される請求の範囲9または10記載の2-アミノ-1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

12. 一般式

$$\begin{array}{c} CH_2OH \\ H_2N & \longrightarrow & C \\ \hline & --- & CH_2OH \\ Rg \end{array}$$
 (I-10)

〔式中、Rg はアルキル部の炭素数が6~20個であって、直鎖または分枝鎖状

でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が1または2個介在していてもよいフェニルアルキル:炭素数6~14個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルキル、炭素数6~14個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルコキシ、炭素数6~14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、フェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシ、フェニルアルコキシ、フェニルアルコキシ、フェニルアルコキシ、フェニルアルコキシ、フェニルアルコキシ、カロフェニルアルキルにより置換されたフェニルアルキル;アルキル部の炭素数が6~20個であるシクロアルキルアルキル;炭素数6~14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロアリールアルキル;アルキル部の炭素数が6~20個であるヘテロアリールアルキル;大素数6~14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロサイクリックアルキルを示す。)により表される請求の範囲9、10または11記載の2~アミノー1、3~プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

13. 一般式

〔式中、Rh はアルキル部の炭素数が $6\sim20$ 個であるフェニルアルキル、アルキル部およびアルコキシ部の炭素数の総計が $6\sim20$ 個であるフェニルアルコキシアルキル、アルキル部の炭素数が $6\sim20$ 個であるフェノキシアルキルまたはアルキル部およびアルコキシ部の炭素数の総計が $6\sim20$ 個であるフェノキシアルコキシアルキルを示す。〕により表される請求の範囲12記載の2-アミノー1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

14. 2-rミノー 2-(8-7)ェニルオクチル) -1, 3-7ロパンジオール、2-rミノー 2-(9-7)ェニルノニル) -1, 3-7ロパンジオール、2

- r ミ ノ - 2 - (10 - 7 ェニルデシル) - 1 、 3 - プロパンジオール、<math>2 - 7ミノー2-(11-フェニルウンデシル)-1、3-プロパンジオール、2-ア ミノー2-(12-フェニルドデシル)-1,3-プロパンジオール、2-アミ ノー2-(13-フェニルトリデシル)-1,3-プロパンジオール、2-アミ ノー2-(14-フェニルテトラデシル)-1,3-プロパンジオール、2-ア ミノー2-(15-フェニルペンタデシル)-1,3-プロパンジオール、2-アミノー2-(16-フェニルヘキサデシル)-1,3-プロパンジオール、2 - アミノー 2 ー [6 - (8 -) ェニルオクチルオキシ) ヘキシル) - 1 . 3 - プ ロパンジオール、2-アミノー2-(8-フェニルメチルオキシオクチル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(9-フェノキシノニル)-1,3-プロパンジオール、2-アミノー2-(12-フェノキシドデシル)-1,3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-〔6-(2-フェノキシエチルオキシ) ヘキシル】-1、3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲13記載の2-アミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。 ル、2-アミノ-2-(13-フェニルトリデシル)-1,3-プロパンジオー ル、2-アミノ-2-[6-(8-フェニルオクチルオキシ)へキシル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノー2-(8-フェニルメチルオキシオクチル) 3 -プロパンジオール、2 -アミノー2 - (12 -フェノキシドデシル) - 1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-〔6-〔2-フェノキシエチルオ キシ)へキシル]-1、3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲13記載 の2-アミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。 16. 一般式

〔式中、Ri はハロゲンで置換されていてもよい炭素数 $6\sim1$ 4 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、ハロゲンで置換されていてもよい炭素数 $6\sim1$ 4 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシまたは炭素数 $6\sim1$ 4 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシにより置換されたフェニルアルキルを示す。ここで、フェニルアルキルのアルキル部はヒドロキシで置換されていてもよい。〕により表される請求の範囲 1 2 記載の 2-r > 1 >

17. 一般式

〔式中、Rj はハロゲンで置換されていてもよい炭素数6~14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、ハロゲンで置換されていてもよい炭素数6~14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシまたは炭素数6~14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシにより置換され、かつアルキル部が炭素数2~6のアルキルであって、当該アルキル部がヒドロキシで置換されていてもよいフェニルアルキルを示す。〕により表される請求の範囲16記載の2-アミノ-1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

18. $2-r \ge J-2-(2-(4-n)^2 + J) = 1$, $3-J^2 + J = 1$,

-プロパンジオール、2-アミノー2- (2-(4-ヘキシルオキシフェニル) エチル)-1、3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-〔4-ヘプチル オキシフェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2 - (4-オクチルオキシフェニル)エチル}−1,3-プロパンジオール、2 $r \ge 1 - 2 - (2 - (4 - 1) - 1) + (4$ ジオール、2-アミノー2- (2-(4-デシルオキシフェニル) エチル) -1, 3 -プロパンジオール、2 -アミノー2 - (2 - (4 -ウンデシルオキシフェニ ル) エチル] -1、3-プロパンジオール、2-アミノー2-〔2-(4-ドデ シルオキシフェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-2-アミノ-2-〔2-(4-(8-フルオロオクチル)フェニル)エチル〕-1. 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(12-フルオロド デシル)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール、2-アミノー2-〔 2-(4-(7-フルオロヘプチルオキシ)フェニル)エチル]-1,3-プロ パンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(11-フルオロウンデシルオキ シ)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオールおよび2-アミノー2-〔 2-(4-(7-オクテニルオキシ)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジ オールから選ばれる請求の範囲16または17記載の2-アミノー1,3-プロ パンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

19. $2-r \ge J-2-(2-(4-n)^2 + J) = 1$, 3-J = 1, 3-J

1、3-プロパンジオール、2-アミノー2-[2-(4-ノニルオキシフェニル) エチル] -1、<math>3-プロパンジオール、2-アミノー2-[2-(4-ウンデシルオキシフェニル) エチル] -1、<math>3-プロパンジオールおよび2-アミノー2-[2-(4-(7-オクテニルオキシ) フェニル) エチル] -1、<math>3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲16または17記載の2-アミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

20. 一般式

〔式中、Rk はフェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシアルキル、フェノキシアルコキシまたはフェノキシアルキルにより置換されたフェニルアルキルを示す。〕により表される請求の範囲12記載の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

21. 一般式

$$\begin{array}{c} CH_2OH \\ H_2N \longrightarrow \begin{array}{c} C \\ --- \end{array} CH_2OH \end{array} \qquad (I-15)$$

〔式中、R1 はアルコキシ部の炭素数が2~8 個であるフェニルアルコキシ、アルコキシ部の炭素数が2~8 個であるフェニルアルコキシ、アルコキシ部およびアルキル部の総炭素数が2~8 個であるフェニルアルコキシアルキル、アルコキシ部の炭素数が2~8 個であるフェノキシアルコキシまたはアルキル部の炭素数が2~8 個であるフェノキシアルキルにより置換されたアルキル部の炭素数が2~8 個であるフェノキシアルキルにより置換されたアルキル部の炭素数が2~6 個であるフェニルアルキルを示す。〕により表される請求の範囲20記載の2-アミノー1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

チルオキシ)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2 -[2-(4-(3-))]プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(4-フェニルプチルオキシ) フェニル) エチル] -1, 3-プロパンジオール、2-アミノー2-〔2-〔4- (5-フェニルペンチルオキシ)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオ $-\nu$, 2-r, l = l エチル] -1, 3-プロパンジオール、2-アミノー2- (2-(4-(7-フ) ェニルヘプチルオキシ)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール、2--1, 3 - 7 -1 -1, 3 - 7 -1, 3 -ェニル) ヘキシルオキシ) フェニル) エチル] -1, 3-プロパンジオール、2 エチル] -1, 3-プロパンジオール、<math>2-アミノ-2-[2-(4-(4-7))]ェノキシブチルオキシ)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール、2--1, 3-7 -1 -1, 3-7 ヘキシルオキシ)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール、2-アミノ 3 -プロパンジオール、2 -アミノー2 - (2 - (4 - (4 -) x / 2 +))フェニル) エチル] -1, 3-プロパンジオール、2-アミノー2-〔2-〔4− (5 − フェノキシペンチル)フェニル)エチル)−1,3−プロパンジオール、 $2-r \le J-2-(2-(4-(6-J-J+2)N+2)N)$ キシヘプチル)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオールから選ばれる請 求の範囲20または21記載の2-アミノー1,3-プロパンジオール化合物ま たはその製薬上許容される塩。

23. 2-アミノー2-〔2-(4-(6-フェニルへキシルオキシ)フェニル)エチル〕-1,3-プロパンジオールおよび2-アミノー2-〔2-(4-(5-フェニルペンチルオキシメチル)フェニル)エチル〕-1,3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲20または21記載の2-アミノー1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

24. 一般式

〔式中、Rm はアルキル部の炭素数の総計が $6 \sim 20$ 個であるアルキル置換シクロアルキルアルキルを示す。〕により表される請求の範囲 12 記載の2-r ミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

25. 2-アミノー2-〔3-(4-ヘプチルシクロヘキシル)プロピル〕ー1,3-プロパンジオール、2-アミノー2-〔4-(4-プチルシクロヘキシル)プチル〕-1,3-プロパンジオール、2-アミノー2-〔2-(4-オクチルシクロヘキシル)エチル〕-1,3-プロパンジオール、2-アミノー2-〔2-(4-ノニルシクロヘキシル)エチル〕-1,3-プロパンジオールおよび2-アミノー2-〔2-(4-ドデシルシクロヘキシル)エチル〕-1,3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲24記載の2-アミノー1,3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲24記載の2-アミノー1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

26. 一般式

「式中、Rn はアルキル部の炭素数の総計が $6 \sim 20$ 個である1 -アルキル置換 ピペリジン-4 -イルアルキルを示す。〕により表される請求の範囲 12 記載の 2 -アミノ-1 , 3 -プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。 27 , 2 -アミノ-2 - (2 - (1 - 1 - 1 - 2 - 1 - 3 - 1

28. 一般式

〔式中、 R_0 はアルキル部の炭素数が $6\sim20$ 個であるチエニルアルキル、アルキル部の炭素数の総計が $6\sim20$ 個であるアルキル置換チエニルアルキル、アルキル部の炭素数が $6\sim20$ 個であるピリジルアルキルまたはアルキル部の炭素数の総計が $6\sim20$ 個であるアルキル置換ピリジルアルキルを示す。〕により表される請求の範囲12記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

29. $2-r \ge J-2-(2-(5-t)f)-1$ 3-f)-1 3-f)-1

デシル〕-1, 3-プロパンジオール、<math>2-アミノ-2-(2-(2-オクチル-5-ピリジル) エチル〕-1, 3-プロパンジオール、<math>2-アミノ-2-(2-(2-7)) エチル〕-1, 3-プロパンジオールおよび 2-アミノ-2-(13-(3-ピリジル)) トリデシル〕<math>-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲 28記載の <math>2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

30. 一般式

$$H_2N \longrightarrow CH_2OH$$

$$H_2N \longrightarrow CH_2OH$$

$$R_p$$
(I-19)

〔式中、Rp は炭素数が $6\sim1$ 8 個であるアルキルにより置換されたフェニル、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロサイクルを示す。〕 により表される請求の範囲 1 または 2 記載の 2- アミノー 1 , 3- プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

31. 一般式

〔式中、Rq は炭素数が $6 \sim 1$ 8 個であるアルキルにより置換されたフェニルを示す。〕により表される請求の範囲 3 0 記載の 2 - 7 ミノー 1 , 3 - 7 ロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

32. 2-rミノー2-(4-r)シルフェニル)-1, 3-rロパンジオール、2-rミノー2-(4-r)デシルフェニル)-1, 3-rロパンジオール、2-rミノー2-(4-r)ラデシルフェニル)-1, 3-rロパンジオールおよび2-rミノー2-(4-r)ウルフェニル)-1, 3-rロパンジオールから選ばれる請求の範囲 30 または 31 記載の2-rミノー1, 3-rロパンジオ

ール化合物またはその製薬上許容される塩。

33. 一般式

$$CH_2OR^4a$$
 $R^2aR^3aN \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OR^5a$
 $(I-21)$
 $CH(OH)R^1$

(式中、R¹ は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖 {当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N (R°)-(ここで、R° は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいへテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端(ω位)に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいアリールもしくはその脂環体が置換していてもよい}または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体を示し、R²a、R³a、R⁴a、R⁵aは同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルコトン、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。」により表される請求の範囲1または2記載の2-アミノー1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

34. 一般式

[式中、Rrは鎖中に二重結合またはカルボニルを有していてもよく、また水酸基 および/またはヒドロキシイミノにより置換されていてもよいアルキルを示す。] により表される請求の範囲33記載の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化 合物またはその製薬上許容される塩。

35. $2-r \ge J-2-(1, 2, 12-h) = F-1-2-4-h$ 0 -1, $3-J^2-1-2-(1, 2-J^2-1-2-(1, 2-J^2-1-2-1))$ 0 -1, $3-J^2-1-2-(1, 2-J^2-1-2-(1, 2-J^2-1-2-(1, 2-J^2-1-2-1))$ 0 -1, $3-J^2-1-2-(1, 2-J^2-1-2-1)$ 0 -1, $3-J^2-1-2-(1, 12-J^2-1-2-(1, 2, 4-h) = F-1-2-(1, 3-J^2-1-2-(1, 2, 12-h) = F-1-2-(1, 2, 12-h) = F-1-2-(1, 12-J^2-1-2-(1, 12-J^2-1-2-1))$ 0 -1, $3-J^2-1-2-(1, 2, 12-h) = F-1-2-(1, 12-J^2-1-2-1-2-1)$ 1 -1, $3-J^2-1-2-1-2-(1, 12-J^2-1-2-1-2-1)$ 1

デシル) -1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲 <math>3 3 または 3 4 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

36. 一般式

(式中、Rs はハロゲンで置換されていてもよい炭素数 $6\sim1$ 4個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、ハロゲンで置換されていてもよい炭素数 $6\sim1$ 4個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシまたは炭素数 $6\sim1$ 4個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシにより置換されたフェニルアルキルを示す。)により表される請求の範囲 3 3 記載の 2- アミノ- 1, 3- プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

37. $2-r \ge J-2-(1-t)$ 1-t 1-

·38. 一般式

$$CH_2OR^4a$$

$$R^2aR^3aN \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OR^5a \qquad (I-24)$$

$$CH = CHRt$$

〔式中、Rt は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖(当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N (R 6) - (ここで、R 6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいへテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよい)または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体を示し、R 2 a、R 3 a、R 4 a、R 5 aは同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していても

よいへテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。」により表される請求の範囲1または2記載の2-アミノ-1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

39. 一般式

$$H_2N \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OH$$

$$CH = CHRu$$
(I-25)

〔式中、Ru は炭素数が $4 \sim 16$ 個であるアルキルにより置換されたフェニルを示す。〕により表される請求の範囲 38 記載の 2- アミノー 1 , 3- プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

41. 一般式

$$CH_2OR^4a$$
 $R^2aR^3aN \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OR^5a$
 $(CH_2)\alpha X(CH_2)BRV$

(1-26)

[式中、Rv は置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよい

シクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体を示し、 R^2a 、 R^3a 、 R^4a 、 R^5a は同一または異なってぞれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示し、Xは酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N (R^6) - (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)を示し、 α 、 β は0または $1\sim2$ 0の整数 (但し、 $\alpha+\beta$ は $5\sim2$ 0である)を示す。

また、上記置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。」により表される請求の範囲1または2記載の2-アミノ-1、3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

42. 一般式

$$CH_2OH$$
 $H_2N \longrightarrow C \longrightarrow CH_2OH$
 CH_2ORw
 $(I-27)$

〔式中、Rw は炭素数が4~16個であるアルキルにより置換されたフェニルを示す。〕により表される請求の範囲41記載の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

43. 2-rミノー2-(4-x)クチルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオール、2-rミノー2-(4-デシルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノー2-(4-ドデシルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノー2-(4-テトラデシルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲41または42記載の2-

アミノー1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

44. 請求の範囲1~4のいずれかに記載の化合物を含有してなる医薬組成物。

45. 一般式

$$R^{2}R^{3}N \longrightarrow C \longrightarrow CH_{2}OR^{5}$$
 (I-28)

【式中、Rは置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖 {当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N (R⁶)-(ここで、R⁶ は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいへテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいへテロアリールもしくはその脂環体が置換していてもよい}または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいアリールもしくはその脂環体を示し、R²、R³、R⁴、R⁵ は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示すか、R⁴、R⁵ がアルキル、アリールまたはアラルキルにより置換されていてもよいアルキレン鎖により結合していてもよい。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロア

ルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体から 選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよい シクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはそ の脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、 アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチ オ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシ ルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハ ロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。 さらに、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリー ルオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していて もよいヘテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルキル、アルコキ シ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオー キシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカル ボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、 ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カル ボキシから選ばれる基を有していてもよい。〕により表される2-アミノ-1、 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩を含有してなる免疫 抑制剂。

- 46. 請求の範囲1~43のいずれかに記載の2-アミノー1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩を含有してなる免疫抑制剤。
- 47. 免疫抑制剤が拒絶反応抑制剤である請求の範囲 45 または 46 記載の薬剤。
- 48. 免疫抑制剤が自己免疫疾患の予防または治療薬である請求の範囲 45または46記載の薬剤。
- 49. 自己免疫疾患の予防または治療薬がリウマチの予防または治療薬である請求の範囲48記載の薬剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

	_		PCT/JP	93/01515
Int.	A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int. C1 ⁵ C07C215/10, C07C233/18, C07C215/24, C07C215/28, C07C323/25, C07C225/06, C07C229/22, C07C219/04, According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC			
	DS SEARCHED			
Int.	Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int. C1 ⁵ C07C215/02-215/40, C07C217/28-217/40, C07C219/04-219/16 C07C225/02-225/18, C07C229/22, C07C233/18, C07C323/25,			
	ion searched other than minimum documentation to the ex			
	ata base consulted during the international search (name o	of data base and, where	practicable, search t	erms used)
C. DOCU	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT			
Category*	Citation of document, with indication, where ap	propriate, of the relev	vant passages	Relevant to daim No.
Х	"Merck Index" 11th Edition Inc., p. 1536-1537 [9684. T			1
Х	JP, A, 63-2904 (SS Pharmace January 7, 1988 (07. 01. 88 Page 5, (Family: none)		Ltd.),	1
х	JP, A, 57-156459 (Mitsui To Inc.), September 27, 1982 (27. 09. Page 5, (Family: none)		als,	1
х	JP, A, 58-101108 (Unitika, June 16, 1983 (16. 06. 83),	Ltd.), (Family:	none)	1
х	JP, A, 4-173723 (Kao Corp.) June 22, 1992 (22. 06. 92),	(Family:	none)	1
X	JP, A, 63-43140 (Fuji Photo February 24, 1988 (24. 02. Page 3, (Family: none)		Ltd.),	1
X Furthe	er documents are listed in the continuation of Box C.	See patent	t family annex.	
"A" docume to be of	categories of cited documents: ent defining the general state of the art which is not considered f particular relevance	date and not in the principle or	conflict with the appli theory underlying the	
"L" docume	document but published on or after the international filing date ent which may throw doubts on priority claim(s) or which is n establish the publication date of another citation or other reason (as specified)	considered nov step when the d "Y" document of pa	rel or cannot be considered or cannot be considered along the construction of the cons	claimed invention cannot be
"O" docume means "P" docume	ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or other ent published prior to the international filing date but later than ority date claimed	combined with being obvious t		
•	actual completion of the international search	Date of mailing of t	he international sea	rch report
	ary 10, 1994 (10. 01. 94)	February 1	., 1994 (01	02. 94)
Name and n	nailing address of the ISA/	Authorized officer		

Telephone No.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

Facsimile No.

Japanese Patent Office

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No. PCT/JP93/01515

C (Continu	ation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT	
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Х	JP, A, 4-69320 (Kao Corp.), March 4, 1992 (04. 03. 92), (Family: none)	1
X	JP, A, 51-54565 (Toa Eiyo K.K.), May 13, 1976 (13. 05. 76), Page 3, (Family: none)	1
х	JP, A, 4-9309 (Kao Corp.), January 14, 1992 (14, 01, 92) & EP, A2, 450527	1
х	<pre>JP, A, 57-21366 (Mitsui Toatsu Chemicals, Inc.), February 4, 1982 (04. 02. 82), Page 5 & EP, A2, 44203</pre>	1
Х	US, A, 3660488 (Phillips Petroleum Company), May 2, 1972 (02. 05. 72), (Family: none)	1
х	US, A, 3432603 (Sterling Drug Inc.), March 11, 1969 (11. 03. 69), (Family: none)	1 .
Х	US, A, 3426042 (Union Carbide Corporation), February 4, 1969 (04. 02. 69), (Family: none)	1
х	US, A, 3324043 (Sterling Drug Inc.), June 6, 1967 (06. 06. 67), (Family: none)	1
P	<pre>JP, A, 5-78294 (Kao Corp), March 30, 1993 (30. 03. 93), (Family: none)</pre>	1
х	JP, A, 4-224548 (Kao Corp.), August 13, 1992 (13. 08. 92), (Family: none)	1
·		
1		
		·

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP93/01515

A(Continuation). CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07C217/28, A61K31/13, A61K31/195, A61K31/215, A61K31/24

B(Continuation). FIELDS SEARCHED

A61K31/13, A61K31/195, A61K31/215, A61K31/24

	•	四水间里状口		0.0101
B. 調査を行った分野 国政を行ったが内野 Int、C2 C07C215/02-215/40, C07C217/28-217/40, C07C219/04-219/16, C07C225/02-225/18, C07C229/22, C07C233/18, C07C225/02-225/18, C07C229/22, C07C233/18, C07C323/25, 金小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの 国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語) CAS ONLINE C. 関連すると認められる文献 引用文献のカデゴリー* X	A. 発明の厚	Int. CL ⁵ C07C215/1	0, C07C233/18, C0	7 C 2 1 5 / 24,
B. 調査を行った分野 国本を行った分野 Int、CL ² CO7C215/02-215/40, CO7C217/28-217/40, CO7C229/22, CO7C233/18, CO7C225/02-225/18, CO7C229/22, CO7C233/18, CO7C323/25, 金小限質料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの GI開資金で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した開語) CAS ONLINE C. 関連すると認められる文献 引用文献を 及び一部の箇所が関連するときは、その間差する箇所の表示				7 C 2 2 5 / 0 6,
関連を行った数小模製件(国際特許分類(IPC))		C07C229/2	2. C07C219/04. C0	7 C 2 1 7/28,
Int. C4 ³ C07C215/02-215/40, C07C21728-217/40, C07C219/04-219/16, C07C225/02-225/18, C07C229/22, C07C233/18, C07C323/25, 各小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの 国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用節)	B. 調査を行	テった分野		
CO7C229/22 、CO7C225/02-225/18。CO7C225/02-225/18。CO7C229/22 、CO7C233/18 、CO7C323/25。 最小限資料以外の資料で開産を行った分野に含まれるもの 国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語) CAS ONLINE C. 関連すると認められる文献 引用文献のカテブリー*	調査を行った最	B小限資料(国際特許分類(IPC))	2-215/40 0070217	/28-217/40
				20 211/40,
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの 国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)		0070219/04	-219/10, CU/C223/U/	7 C 3 2 3 / 2 5.
C. 関連すると認められる文献 引用文献の カテゴリー*	最小限資料以外		, 00,0200, 20,	, , , , , , , , , , , , , , , , , , , ,
C. 関連すると認められる文献 引用文献の カテゴリー*				
	国際調査で使用		をに使用した用語) ・	
別用文献の カテゴリー*		CAS ONLINE		
別用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	C. 関連する	 ると認められる文献		
# Co. , Inc. , p. 1536—1537 [9684. Tromethamine] X	引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連す	するときは、その関連する箇所の表示	
7. 1月. 1988(07. 01. 88), 第5ペーシ(ファミリーなし) X JP,A,57-156459(三井東圧化学株式会社), 1 V C圏の統きにも文献が列挙されている。 * 引用文献のカテゴリー 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの「E」先行文献ではあるが、国際出願目以後に公表されたもの「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す) 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献 国際調査を完了した日 国際調査を完了した日 国際調査を完了した日 国際調査を発行した日 国際調査を発行した日 国際調査を発行して、国際は、15名/JP) ・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・	Х	& Co., Inc., p. 1536-	dition (1989) Merck -1537 [9684. Trometha-	1
▼ C翻の続きにも文献が列挙されている。 * 3 用文献のカテゴリー 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」先行文献ではあるが、国際出顧日以後に公表されたもの 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日 若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」国際出顧日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出顧の日 の後に公表された文献 国際調査を完了した日 10.01.94 「T」国際出願日とは優先日後に公表された文献であって出願と 矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のため に引用するもの 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規 性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文 献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性 がないと考えられるもの 「②」同一パテントファミリー文献 国際調査報告の発送日 10.01.94 「特許庁審査官(権限のある職員) 「Yテントファミリーに関する別紙を参照。 「A」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規 性文は進歩性がないと考えられるもの 「②」同一パテントファミリー文献 国際調査報告の発送日 「A 日 特許庁・審査官・(権限のある職員) 「 A 日 イ 日 7 4 5 7 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日	x	7. 1月. 1988(07. 01.	88),	1
* 引用文献のカテゴリー 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日音しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「ア」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献 「B」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献 「A」 4 5 7 国際関査を完了した日 国際調査報告の発送日 「A」 0 1 9 4 「A 5 7 事項番号」00 東京都千代田区酸が関三丁目4番3号	x	JP,A,57-156459(=	E井東圧化学株式会社),	1
「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」先行文献ではあるが、国際出顧日以後に公表されたもの 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日 若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」国際出顧日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出顧の日の後に公表された文献 国際調査を完了した日 10.01.94 名称及びあて先 日本国特許庁(ISA/JP) 郵便番号100 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	✓ C棚の統	きにも文献が列挙されている。	□ パテントファミリーに関する別紙	を参照。
10.01.94 01.02.94 01.02.94 8	「A」特に関す 「E」先行文権 「L」優先権 若しく(で理由: 「O」ロ頭に 「P」国際出	連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの 主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日 は他の特別な理由を確立するために引用する文献 を付す) よる開示、使用、展示等に言及する文献 願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日	矛盾するものではなく、発明の原理 に引用するもの 「X」特に関連のある文献であって、当該 性又は進歩性がないと考えられるも 「Y」特に関連のある文献であって、当該 献との、当業者にとって自明である。 がないと考えられるもの	又は理論の理解のため 文献のみで発明の新規 の 文献と他の1以上の文
名称及びあて先 日本国特許庁(ISA/JP) 郵便番号100 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号 特許庁審査官(権限のある職員) 4 H 7 4 5 7	国際調査を完	了した日		
日本国特許庁(ISA/JP) 郵便番号100 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号 BB 村 善 BB 村 BB BB		10.01.94	01.02.94	
	日本	本国特許庁(ISA/JP) 郵便番号100	路村 善 中 4	1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1

様式PCT/ISA/210 (第2ページ) (1992年7月)

C (続き).	関連すると認められる文献	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
1	27.9月.1982(27.09.82), 第5ページ(ファミリーなし)	
X	JP,A,58-101108(ユニチカ株式会社), 16.6月.1983(16.06.83)(ファミリーなし)	1
x	JP,A,4-173723(花王株式会社), 22.6月.1992(22.06.92)(ファミリーなし)	1
X	JP,A,63-43140(富土写真フィルム株式会社), 24.2月.1988(24.02.88), 第3ページ(ファミリーなし)	1
x	JP,A,4-69320(花王株式会社), 4.3月,1992(04,03,92)(ファミリーなし)	1
X	JP,A,51-54565(東亜栄養株式会社), 13.5月.1976(13.05.76), 第3ページ(ファミリーなし)	1
X .	JP,A,4-9309(花王株式会社), 14,1月,1992(14,01,92) &EP,A2,450527	1
X	JP,A,57-21366(三井東圧株式会社), 4.2月,1982(04,02,82), 第5ページ&EP,A2,44203	1
x	US,A,3660488 (Phillips Petroleum Company), 2.5月、1972(02.05.72)(ファミリーなし)	1
X	US,A,3432603(Sterling Drug Inc.), 11.3月、1969(11.03.69)(ファミリーなし)	1
X	US,A,3426042(Union Carbide Corporation), 4.2月、1969(04、02、69)(ファミリーなし)	1
X	US,A,3324043 (Sterling Drug Inc.), 6.6月、1967(06.06.67)(ファミリーなし)	1
P	JP,A,5-78294(花王株式会社), 30.3月,1993(30.03.93)(ファミリーなし)	1
x	JP,A,4-224548(花王株式会社), 13.8月,1992(13.08.92)(ファミリーなし)	1

A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPO))

A61K31/13, A61K31/195, A61K31/215, A61K31/24

B. 調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPO))

A61K31/13, A61K31/195, A61K31/215. A61K31/24

様式PCT/ISA/210 (特別ページ) (1992年7月)

13

. 3